

(19) 世界知的所有権機関
国際事務局



(43) 国際公開日
2001 年 6 月 7 日 (07.06.2001)

PCT

(10) 国際公開番号
WO 01/40227 A1

(51) 国際特許分類: C07D 471/10, A61K
31/499, 31/5377, A61P 29/00, 11/06, 17/00, 17/04, 37/08,
13/12, 1/16, 19/02, 29/00, 17/06, 27/16, 27/14, 9/10, 1/04,
11/00, 9/02, 3/10, 37/06, 35/04

Shin-ichi) [JP/JP]. 柴山 史朗 (SHIBAYAMA, Shiro)
[JP/JP]. 高岡義和 (TAKAOKA, Yoshikazu) [JP/JP]; 〒
618-8585 大阪府三島郡島本町桜井3丁目1番1号 小野
薬品工業株式会社 水無瀬総合研究所内 Osaka (JP).

(21) 国際出願番号: PCT/JP00/08517

(74) 代理人: 弁理士 大家邦久, 外(OHIE, Kunihisa et
al.); 〒103-0013 東京都中央区日本橋人形町2丁目2番
6号 堀口第2ビル7階 大家特許事務所 Tokyo (JP).

(22) 国際出願日: 2000 年 12 月 1 日 (01.12.2000)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(81) 指定国 (国内): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB,
BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,
DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL,
IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU,
LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, PL,
PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ,
UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW.

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:
特願平11/344967 1999 年 12 月 3 日 (03.12.1999) JP
特願平 2000-18673
2000 年 1 月 27 日 (27.01.2000) JP
特願平2000-27968 2000 年 2 月 4 日 (04.02.2000) JP
特願平 2000-147882
2000 年 5 月 19 日 (19.05.2000) JP

(84) 指定国 (広域): ARIPO 特許 (GH, GM, KE, LS, MW,
MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), ユーラシア特許 (AM,
AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ特許
(AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT,
LU, MC, NL, PT, SE, TR), OAPI 特許 (BF, BJ, CF, CG,
CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野
薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.,
LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府大阪市中央区道修町
2丁目1番5号 Osaka (JP).

添付公開書類:
— 国際調査報告書

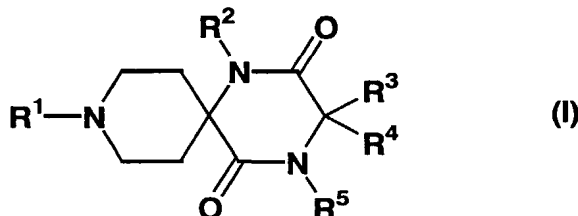
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 巾下 広
(HABASHITA, Hiromu) [JP/JP]. 浜野進一 (HAMANO,

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される
各 PCT ガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語
のガイダンスノート」を参照。

(54) Title: TRIAZASPIRO[5.5]UNDECANE DERIVATIVES AND DRUGS CONTAINING THE SAME AS THE ACTIVE IN-
GREDIENT

(54) 発明の名称: トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤



(57) Abstract: Triazaspiro[5.5]undecane derivatives represented by general formula (I), quaternary ammonium salts thereof, N-ox-
ides thereof and nontoxic salts thereof, wherein each symbol has the meaning as defined in the description. Because of controlling
the effects of chemokines/chemokine receptors, the compounds represented by general formula (I) are useful in preventing and/or
treating various inflammatory diseases, asthma, atopic dermatitis, urticaria, allergic diseases, nephritis, nephropathy, hepatitis, arthri-
tis, rheumatoid arthritis, etc.

[続葉有]

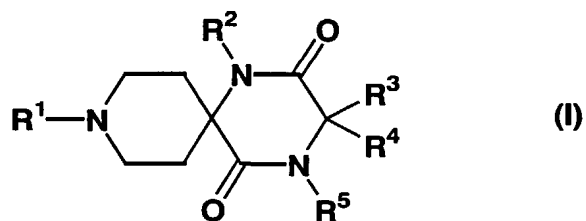


WO 01/40227 A1



(57) 要約:

一般式 (I) で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシド、それらの非毒性塩、またはそれを有効成分として含有する薬剤（式中の記号は明細書に記載の通り。）。



一般式 (I) で示される化合物は、ケモカイン／ケモカイン受容体の作用を制御するので、各種炎症性疾患、喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ等の予防および／または治療に有用である。

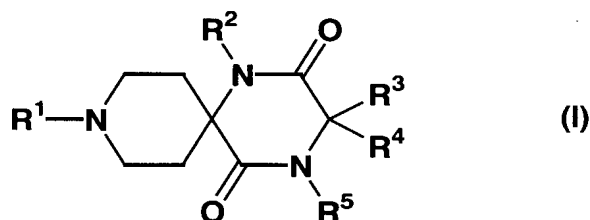
明 細 書

トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体およびそれらを有効成分とする薬剤

5 技術分野

本発明は、トリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体、およびそれらを有効成分として含有する薬剤に関する。

さらに詳しくは、一般式（I）



- 10 （式中、すべての記号は後記と同じ意味を表わす。）で示されるトリアザスピロ[5.5]ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシド、それらの非毒性塩、それらの製造方法、およびそれらを有効成分として含有する薬剤に関する。

15 背景技術

ケモカインは、内因性の白血球走化性、活性化作用を有し、ヘパリン結合性の強い、塩基性蛋白質として知られている。現在では、ケモカインは、炎症、免疫反応時の特異的白血球の浸潤を制御するのみならず、発生、生理的条件下でのリンパ球のホーミング、血球前駆細胞、体細胞の移動にも関わる

20 と考えられている。

血球細胞は種々のサイトカインによって、その分化、増殖、細胞死が制御されている。生体内において炎症は局所的にみられ、リンパ球の分化、成熟等はある特定の部位で行なわれている。すなわち、必要とされる種々の細胞

が、ある特定の部位に移動し、集積して、一連の炎症、免疫反応が起こる。従って、細胞の分化、増殖、死に加えて、細胞の移動も免疫系にとって必要不可欠な現象である。

生体内での血球細胞の移動は、まず、発生過程において、A G M領域に始まる造血が胎児肝を経て、骨髓での永久造血へと移行することから始まる。更に、胎児肝、骨髓から胸腺へと、T細胞、胸腺樹状細胞の前駆細胞が移動し、胸腺環境下で細胞分化する。クローン選択を受けたT細胞は、二次リンパ組織へ移動し、末梢における免疫反応に関与する。抗原を捕らえて、活性化、分化した皮膚のランゲルハンス細胞は、局所リンパ節のT細胞領域に移動し、樹状突起細胞としてナイーブT細胞を活性化する。メモリーT細胞はリンパ管、血管を経て、再びリンパ節にホーミングする。また、B細胞、腸管上皮内T細胞、 $\gamma\delta$ T細胞、NK T細胞、樹状細胞は、骨髓より胸腺を経ずに移動、分化し、免疫反応に関与する。

ケモカインは、このような種々の細胞の移動に深く関与している。例えば、M I P 3 β 、S L Cとその受容体であるC C R 7は、抗原を捕らえた成熟樹状細胞が、ナイーブT細胞およびメモリーT細胞と効率良く出会うために、これらの細胞の局所リンパ組織への移動、ホーミングにおいて重要な働きをしている。S L Cの発現に欠損があるP L Tマウスの二次リンパ節には、抗原特異的な免疫反応を司るために必要なT細胞、並びに樹状細胞がほとんど観察されない (J. Exp. Med., 189 (3), 451 (1999))。

M D C、T A R Cとその受容体であるC C R 4は、T h 2細胞の関わる免疫、炎症反応において、T h 2細胞の局所への移動に重要な働きをしている。ラット劇症肝炎モデル (P.acnes + L P S) において、抗T A R C抗体は、血中A L T量の上昇、および肝臓中T N F α 、F a s Lの発現量の上昇を抑制し、更にラット致死率を改善した (J. Clin. Invest., 102, 1933 (1998))。また、マウスO V A誘発気道過敏性モデルにおいて、抗M D C抗体は肺間質に集積

する好酸球数を減らし、気道過敏性を抑制した（J. Immunology, 163, 403 (1999)）。

MCP-1とその受容体であるCCR2は、マクロファージの炎症部位への浸潤に関与している。抗MCP-1抗体は、ラット抗Thy1.1抗体腎
5 炎モデルにおいて、糸球体への単球、マクロファージの浸潤に対する抑制効果を示した（Kidney Int., 51, 770 (1997)）。

このように、ケモカイン受容体は、種々の特異的な細胞において、ある特定した時期に発現し、そのエフェクター細胞がケモカインの産生される個所に集積するというメカニズムを通じて、炎症、免疫反応の制御に大きく関与
10 している。

ヒト免疫不全ウイルス（以下、HIVと略する。）感染によって引き起こされる後天性免疫不全症候群（エイズ（AIDS）と呼ばれている。）は、近年最もその治療法を切望されている疾患の一つである。主要な標的細胞であるCD4陽性細胞にHIVの感染が一度成立すると、HIVは患者の体内
15 で増殖をくり返し、やがては免疫機能を司るT細胞を壊滅的に破壊する。この過程で徐々に免疫機能が低下し、発熱、下痢、リンパ節の腫脹等の様々な免疫不全状態を示すようになり、カリニ肺炎等の種々の日和見感染症を併発し易くなる。このような状態がエイズの発症であり、カボジ肉腫等の悪性腫瘍を誘発し、重篤化することはよく知られている。

20 現在エイズに対する各種の予防、治療方法としては、例えば、（1）逆転写酵素阻害剤やプロテアーゼ阻害剤の投与によるHIVの増殖抑制、（2）免疫賦活作用のある薬物の投与による日和見感染症の予防、緩和等が試みられている。

HIVは、免疫系の中枢を司るヘルパーT細胞に主に感染する。その際、
25 T細胞の膜上に発現している膜蛋白CD4を利用することは、1985年より知られている（Cell, 52, 631 (1985)）。CD4分子は433個のアミノ酸残

基からなり、成熟ヘルパーT細胞以外にマクロファージ、一部のB細胞、血管内皮細胞、皮膚組織のランゲルハンス細胞、リンパ組織にある樹状細胞、中枢神経系のグリア細胞等で発現が見られる。しかし、CD4分子のみではHIVの感染が成立しないことが明らかになるにつれて、HIVが細胞に感染する際にかかわるCD4分子以外の因子の存在の可能性が、示唆されるようになった。

1996年になって、CD4分子以外のHIV感染にかかわる因子としてFusinという細胞膜蛋白が同定された（Science, 272, 872 (1996)）。このFusin分子は、ストローマ細胞由来因子-1（Stromal Derived Factor-1：SDF-1と略する。）の受容体（すなわち、CXCR4である）であることが証明された。更に、インビトロでSDF-1が、T細胞指向性（X4）HIVの感染を特異的に抑制することも証明された（Nature, 382, 829 (1996)、Nature, 382, 833 (1996)）。すなわち、SDF-1がHIVより先にCXCR4に結合することによって、HIVが細胞に感染するための足掛かりを奪い、HIVの感染が阻害されたと考えられる。

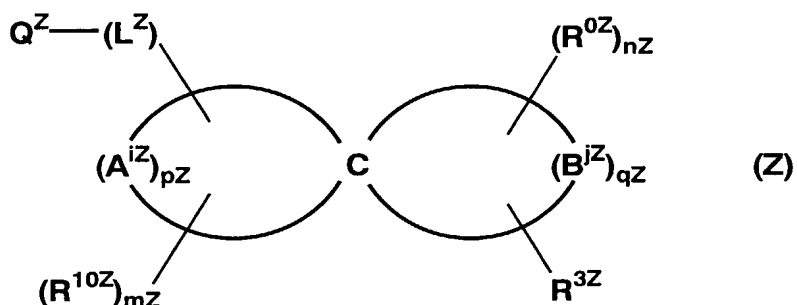
また同じ頃、別のケモカイン受容体であり、RANTES、MIP-1 α 、MIP-1 β の受容体であるCCR5も、マクロファージ指向性（R5）HIVが感染する際に利用されることが発見された（Science, 272, 1955 (1996)）。

従って、HIVとCXCR4やCCR5を奪い合うことのできるもの、あるいはHIVウイルスに結合し、該ウイルスがCXCR4やCCR5に結合できない状態にさせるものは、HIV感染阻害剤となり得るはずである。また当初、HIV感染阻害剤として発見された低分子化合物が、実はCXCR4のアンタゴニストであることが示された例もある（Nature Medicine, 4, 72 (1998)）。

以上から、ケモカイン／ケモカイン受容体は、炎症、免疫疾患またはHIV感染に深く関与していると考えられる。例えば、各種炎症性疾患、喘息、

- アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患（アレルギー性気管支肺アスペルギルス症、アレルギー性好酸球性胃腸症等）、腎炎、腎症、肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ、乾癬、鼻炎、結膜炎、虚血再灌流傷害の抑制、多発性硬化症、潰瘍性大腸炎、急性呼吸窮迫症候群、細菌感染に伴うショック、糖尿病、自己免疫疾患の治療、移植臓器拒絶反応、免疫抑制、癌転移予防、後天性免疫不全症候群に関与していると考えられる。

一方、WO97/11940 号明細書には、一般式 (Z)



- (式中、 A^{iZ} および B^{jZ} はそれぞれ別個に炭素、窒素、酸素または硫黄から選ばれ（ただし、 A^{iZ} の少なくとも1個の原子は炭素であり、かつ少なくとも1個の B^{jZ} は炭素である。））；

A^{iZ} および B^{jZ} によって形成されるスピロ二環は、それぞれ場合によって部分的に不飽和であってもよく、

- pZ および qZ はそれぞれ別個に2から6までの数であり、
- mZ は0から pZ までの数であり、
- R^{10Z} は同じかまたは異なっており、水素、アルキル、ハロ置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、 $=O$ 、 $=S$ 等からそれぞれ別個に選ばれる非干渉性置換基であり、
- nZ は0から qZ までの数であり、
- R^{0Z} は同じかまたは異なっており、水素、アルキル、ハロ置換アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、 $=O$ 、 $=S$ 等からそれぞれ別個に

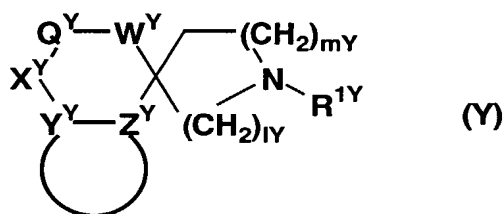
選ばれる非干渉性置換基であり、

— (L^Z) — は結合であるかまたは、炭素、窒素、硫黄および酸素から選ばれる 1 個から 10 個の原子からなる二価の置換もしくは非置換鎖であり、

Q^Z は 1 個または 2 個以上の塩基性ラジカルを含む塩基性基であり、かつ

- 5 R^{3Z} は 1 個または 2 個以上の酸性ラジカルを含む酸性基である。) で示される化合物が血小板凝集抑制に有用である旨の記載がある。

また、WO98/25605 号明細書には、一般式 (Y)



- (式中、mY または lY は、それぞれ独立して、0、1、2、3、4 または
- 10 5 を表わし、

R^{1Y} は、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基等を表わし、

W^Y は、単結合、C 1 ~ 3 アルキル基、オキソ等で置換した C 1 ~ 3 アルキル基等を表わし、

- 15 Q^Y は、—NR²—、—O—、—S—、—S(O)— または —SO₂— を表わし、
- X^Y は、単結合、C 1 ~ 3 アルキル基、オキソ等で置換した C 1 ~ 3 アルキル基等を表わし、

- Y^Y—Z^Y 環は、フェニル、ナフチル、ヘテロアリールを表わす。ただし、各記号の定義は、一部を抜粋したものである。) で示される化合物がケモカイン受容体モジュレーターとして有用である旨の記載がある。
- 20

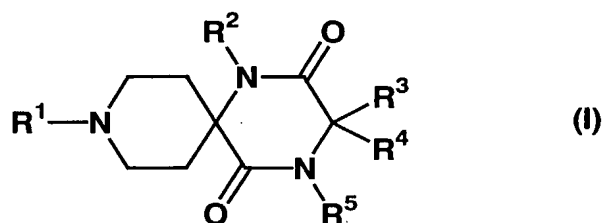
発明の開示

本発明者らは、種々のケモカイン／ケモカイン受容体の作用を制御する化

化合物を見出すべく鋭意検討を重ねた結果、一般式（I）で示されるトリアザスピロ〔5. 5〕ウンデカン誘導体が、本発明の目的を達成することを見出し、本発明を完成した。

本発明は、

5 i) 一般式（I）



[式中、R¹は、

- (1) 水素原子、
- (2) C 1～18 アルキル基、
- 10 (3) C 2～18 アルケニル基、
- (4) C 2～18 アルキニル基、
- (5) -COR⁶、
- (6) -CONR⁷R⁸、
- (7) -COOR⁹、
- 15 (8) -SO₂R¹⁰、
- (9) -COCOR¹¹、
- (10) -CONR¹²COR¹³、
- (11) Cyc 1、または
- (12) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) -CONR⁷R⁸、
- 20 (c) -COOR⁹、(d) -OR¹⁴、(e) -SR¹⁵、(f) -NR¹⁶R¹⁷、(g) -NR¹⁸COR¹⁹、(h) -SO₂NR²⁰R²¹、(i) -OCOR²²、(j) -NR²³SO₂R²⁴、(k) -NR²⁵COOR²⁶、(l) -NR²⁷CONR²⁸R²⁹、(m) Cyc 1、
- (n) ケト基、(o) -N(SO₂R²⁴)₂によって置換された C 1～18 アルキル

基、C 2～18アルケニル基、またはC 2～18アルキニル基を表わし、

(基中、 $R^6 \sim R^9$ 、 $R^{11} \sim R^{21}$ 、 R^{23} 、 R^{25} および $R^{27} \sim R^{29}$ はそれぞれ独立して、

- (1) 水素原子、
- 5 (2) C 1～8アルキル基、
- (3) C 2～8アルケニル基、
- (4) C 2～8アルキニル基、
- (5) Cyc 1、または
- (6) 任意に選ばれた1～5個の(a) Cyc 1、(b)ハロゲン原子、(c) $-OR^{30}$ 、
- 10 (d) $-SR^{31}$ 、(e) $-NR^{32}R^{33}$ 、(f) $-COOR^{34}$ 、(g) $-CONR^{35}R^{36}$ 、
- (h) $-NR^{37}COR^{38}$ 、(i) $-NR^{39}SO_2R^{40}$ 、(j) $-N(SO_2R^{40})_2$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、またはC 2～8アルキニル基を表わすか、
- R^7 と R^8 、 R^{20} と R^{21} 、 R^{28} と R^{29} は一緒になって、1) C 2～6アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-$ 、
- 15 3) $-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-$ 、または
- 4) $-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-NR^{195}-(C 2 \sim 6 \text{アルキレン基})-$ を表わし(基中、 R^{195} は、水素原子、C 1～8アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)、

- 20 R^{10} 、 R^{22} 、 R^{24} および R^{26} はそれぞれ独立して、

- (1) C 1～8アルキル基、
- (2) C 2～8アルケニル基、
- (3) C 2～8アルキニル基、
- (4) Cyc 1、または
- 25 (5) 任意に選ばれた1～5個の(a) Cyc 1、(b)ハロゲン原子、(c) $-OR^{30}$ 、
- (d) $-SR^{31}$ 、(e) $-NR^{32}R^{33}$ 、(f) $-COOR^{34}$ 、(g) $-CONR^{35}R^{36}$ 、

(h) $-NR^{37}COR^{38}$ 、(i) $-NR^{39}SO_2R^{40}$ 、(j) $-N(SO_2R^{40})_2$ によって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、または C 2～8 アルキニル基を表わし、

(基中、 $R^{30} \sim R^{37}$ および R^{39} はそれぞれ独立して、水素原子、C 1～8 アルキル基、C y c 1、または C y c 1 によって置換された C 1～8 アルキル基を表わすか、

R^{35} と R^{36} は一緒になって、1) C 2～6 アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{196}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし (基中、 R^{196} は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換された C 1～8 アルキル基を表わす。)、

R^{38} および R^{40} はそれぞれ独立して、C 1～8 アルキル基、C y c 1、または C y c 1 によって置換された C 1～8 アルキル基を表わす。)

15 C y c 1 は、C 3～15 の単環、二環、または三環式 (縮合またはスピロ) 炭素環、または 1～4 個の窒素原子、1～3 個の酸素原子および/または 1～3 個の硫黄原子を含む 3～15 員の単環、二環、または三環式 (縮合またはスピロ) 複素環を表わす。

ただし、C y c 1 は 1～5 個の R^{51} によって置換されていてもよく、

20 R^{51} は、

- (1) C 1～8 アルキル基、
- (2) C 2～8 アルケニル基、
- (3) C 2～8 アルキニル基、
- (4) ハロゲン原子、

25 (5) ニトロ基、

- (6) トリフルオロメチル基、

- (7) トリフルオロメトキシ基、
 (8) ニトリル基、
 (9) ケト基、
 (10) C y c 2
 5 (11) $-OR^{52}$ 、
 (12) $-SR^{53}$ 、
 (13) $-NR^{54}R^{55}$ 、
 (14) $-COOR^{56}$ 、
 (15) $-CONR^{57}R^{58}$ 、
 10 (16) $-NR^{59}COR^{60}$ 、
 (17) $-SO_2NR^{61}R^{62}$ 、
 (18) $-OCOR^{63}$ 、
 (19) $-NR^{64}SO_2R^{65}$ 、
 (20) $-NR^{66}COOR^{67}$ 、
 15 (21) $-NR^{68}CONR^{69}R^{70}$ 、
 (22) $-B(OR^{71})_2$ 、
 (23) $-SO_2R^{72}$ 、
 (24) $-N(SO_2R^{72})_2$ 、または
 (25) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) C y c 2、(c) $-OR^{52}$ 、
 20 (d) $-SR^{53}$ 、(e) $-NR^{54}R^{55}$ 、(f) $-COOR^{56}$ 、(g) $-CONR^{57}R^{58}$ 、
 (h) $-NR^{59}COR^{60}$ 、(i) $-SO_2NR^{61}R^{62}$ 、(j) $-OCOR^{63}$ 、(k)
 $-NR^{64}SO_2R^{65}$ 、(l) $-NR^{66}COOR^{67}$ 、(m) $-NR^{68}CONR^{69}R^{70}$ 、
 (n) $-B(OR^{71})_2$ 、(o) $-SO_2R^{72}$ 、(p) $-N(SO_2R^{72})_2$ によっ
 て置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキ
 25 ニル基を表わす。)

(基中、 $R^{52} \sim R^{62}$ 、 R^{64} 、 R^{66} および $R^{68} \sim R^{71}$ はそれぞれ独立して、

- 1) 水素原子、2) C 1 ～ 8 アルキル基、3) C 2 ～ 8 アルケニル基、4) C 2 ～ 8 アルキニル基、5) C y c 2、または 6) C y c 2、 $-OR^{73}$ 、 $-COOR^{74}$ 、 $-NR^{75}R^{76}$ によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、C 2 ～ 8 アルキニル基を表わすか、
- 5 R⁵⁷とR⁵⁸、R⁶¹とR⁶²、R⁶⁹とR⁷⁰は一緒になって、1) C 2 ～ 6 アルキレン基、2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{197}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし（基中、R¹⁹⁷は、水素原子、C 1 ～ 8 アルキル基、フェニル基、または
- 10 フェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わす。）
 R⁶³、R⁶⁵、R⁶⁷およびR⁷²はそれぞれ独立して、1) C 1 ～ 8 アルキル基、2) C 2 ～ 8 アルケニル基、3) C 2 ～ 8 アルキニル基、4) C y c 2、または 5) C y c 2、 $-OR^{73}$ 、 $-COOR^{74}$ 、 $-NR^{75}R^{76}$ によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基、C 2 ～ 8 アルケニル基、C 2 ～ 8 アルキニル基を表わし、
- 15 （基中、R⁷³～R⁷⁶はそれぞれ独立して、水素原子、C 1 ～ 8 アルキル基、C y c 2、または C y c 2 によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わす。）
 C y c 2 は C y c 1 と同じ意味を表わす。
 ただし、C y c 2 は 1 ～ 5 個の R⁷⁷によって置換されていてもよく、
- 20 R⁷⁷は、
 1) C 1 ～ 8 アルキル基、
 2) ハロゲン原子、
 3) ニトロ基、
 4) トリフルオロメチル基、
 25 5) トリフルオロメトキシ基、
 6) ニトリル基、

- 7) $-OR^{78}$ 、
 8) $-NR^{79}R^{80}$ 、
 9) $-COOR^{81}$ 、
 10) $-SR^{82}$ 、
 5 11) $-CONR^{83}R^{84}$ 、
 12) C 2～8 アルケニル基、
 13) C 2～8 アルキニル基、
 14) ケト基、
 15) C y c 6、
 10 16) $-NR^{161}COR^{162}$ 、
 17) $-SO_2NR^{163}R^{164}$ 、
 18) $-OCOR^{165}$ 、
 19) $-NR^{166}SO_2R^{167}$ 、
 20) $-NR^{168}COOR^{169}$ 、
 15 21) $-NR^{170}CONR^{171}R^{172}$ 、
 22) $-SO_2R^{173}$ 、
 23) $-N(SO_2R^{167})_2$ 、
 24) 任意に選ばれた 1～5 個の (a) ハロゲン原子、(b) $-OR^{78}$ 、(c) $-NR^{79}R^{80}$ 、(d) $-COOR^{81}$ 、(e) $-SR^{82}$ 、(f) $-CONR^{83}R^{84}$ 、(g) ケト基、
 20 (h) C y c 6、(i) $-NR^{161}COR^{162}$ 、(j) $-SO_2NR^{163}R^{164}$ 、(k) $-OCOR^{165}$ 、(l) $-NR^{166}SO_2R^{167}$ 、(m) $-NR^{168}COOR^{169}$ 、(n) $-NR^{170}CONR^{171}R^{172}$ 、(o) $-SO_2R^{173}$ 、(p) $-N(SO_2R^{167})_2$ によって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わす。)
 25 (基中、 $R^{78} \sim R^{84}$ 、 $R^{161} \sim R^{164}$ 、 R^{166} 、 R^{168} および $R^{170} \sim R^{172}$ はそれぞれ独立して、(a) 水素原子、(b) C 1～8 アルキル基、(c) C 2～8 ア

ルケニル基、(d) C 2～8 アルキニル基、(e) C y c 6、(f) C y c 6、 $-OR^{174}$ 、 $-COOR^{175}$ 、 $-NR^{176}R^{177}$ 、 $-CONR^{178}R^{179}$ によって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わすか、

- 5 R^{83} と R^{84} 、 R^{163} と R^{164} 、 R^{171} と R^{172} は一緒になって、1) C 2～6 アルキレン基、2) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-NR^{198}-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし（基中、 R^{198} は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、
- 10 またはフェニル基によって置換された C 1～8 アルキル基を表わす。）
 R^{165} 、 R^{167} 、 R^{169} および R^{173} はそれぞれ独立して、(a) C 1～8 アルキル基、(b) C 2～8 アルケニル基、(c) C 2～8 アルキニル基、(d) C y c 6、または(e) C y c 6、 $-OR^{174}$ 、 $-COOR^{175}$ 、 $-NR^{176}R^{177}$ 、 $-CONR^{178}R^{179}$ によって置換された C 1～8 アルキル基、C 2～8 アルケニル基、C 2～8 アルキニル基を表わす。）
- 15

（基中、 $R^{174} \sim R^{177}$ はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1～8 アルキル基、3) C y c 6、または 4) C y c 6 によって置換された C 1～8 アルキル基を表わすか、

- R^{178} と R^{179} は一緒になって、1) C 2～6 アルキレン基、2) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-NR^{199}-(C 2～6 \text{ アルキレン基})-$ を表わし（基中、 R^{199} は、水素原子、C 1～8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換された C 1～8 アルキル基を表わす。）
- 20

- 25 C y c 6 は、C 3～8 の単環式炭素環または 1～4 個の窒素原子、1～2 個の酸素原子および／または 1～2 個の硫黄原子を含む 3～8 員の単環式複素

環を表わす。

ただし、C y c 6 は 1 ～ 5 個の R^{180} によって置換されていてもよく、

R^{180} は、

- (1) C 1 ～ 8 アルキル基、
- 5 (2) ハロゲン原子、
- (3) ニトロ基、
- (4) トリフルオロメチル基、
- (5) トリフルオロメトキシ基、
- (6) ニトリル基、
- 10 (7) $-OR^{181}$ 、
- (8) $-NR^{182}R^{183}$ 、
- (9) $-COOR^{184}$ 、
- (10) $-SR^{185}$ 、または
- (11) $-CONR^{186}R^{187}$ を表わし
- 15 (基中、 $R^{181} \sim R^{187}$ はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1 ～ 8 アルキル基、3) フェニル基、または 4) フェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わすか、
- R^{182} と R^{183} 、 R^{186} と R^{187} は一緒になって、1) C 2 ～ 6 アルキレン基、
- 2) $-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-O-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、3) $-(C$
- 20 $2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-S-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ 、または 4) $-(C$
- $2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-NR^{200}-(C 2 \sim 6 \text{ アルキレン基})-$ を表わす (基中、 R^{200} は、水素原子、C 1 ～ 8 アルキル基、フェニル基、フェニル基によって置換された C 1 ～ 8 アルキル基を表わす。))、
- R^2 は、
- 25 (1) 水素原子、
- (2) C 1 ～ 8 アルキル基、

- (3) C 2 ~ 8 アルケニル基、
 (4) C 2 ~ 8 アルキニル基、
 (5) -OR⁹⁰、
 (6) C y c 3、または
- 5 (7) 任意に選ばれた 1 ~ 5 個の (a) ハロゲン原子、(b) -OR⁹⁰、(c) -SR⁹¹、(d) -NR⁹²R⁹³、(e) -COOR⁹⁴、(f) -CONR⁹⁵R⁹⁶、(g) -NR⁹⁷COR⁹⁸、(h) -SO₂NR⁹⁹R¹⁰⁰、(i) -OCOR¹⁰¹、(j) -NR¹⁰²SO₂R¹⁰³、(k) -NR¹⁰⁴COOR¹⁰⁵、(l) -NR¹⁰⁶CONR¹⁰⁷R¹⁰⁸、
 (m) C y c 3、(n) ケト基、(o) -N(SO₂R¹⁰³)₂によって置換された C 1
 10 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基または C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、
 (基中、R⁹⁰ ~ R¹⁰⁰、R¹⁰²、R¹⁰⁴および R¹⁰⁶ ~ R¹⁰⁸はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1 ~ 8 アルキル基、3) C 2 ~ 8 アルケニル基、4) C 2 ~ 8 アルキニル基、5) C y c 3、または 6) C y c 3 によって置換された C
 15 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わすか、
 R⁹⁵と R⁹⁶、R⁹⁹と R¹⁰⁰、R¹⁰⁷と R¹⁰⁸は一緒になって、1) C 2 ~ 6 アルキレン基、2) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - O - (C 2 ~ 6 アルキレン基) -、3) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - S - (C 2 ~ 6 アルキレン基) -、ま
 20 たは 4) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - NR²⁰¹ - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - を表わし (基中、R²⁰¹は、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、フェニル基、またはフェニル基によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基を表わす。)、
 R¹⁰¹、R¹⁰³および R¹⁰⁵はそれぞれ独立して、1) C 1 ~ 8 アルキル基、2) C 2 ~ 8 アルケニル基、3) C 2 ~ 8 アルキニル基、または 4) C y c 3 また
 25 は C y c 3 によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、

C y c 3はC y c 1と同じ意味を表わす。

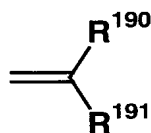
ただし、C y c 3は1～5個の R^{109} によって置換されていてもよく、

R^{109} は R^{51} と同じ意味を表わす。))

R^3 および R^4 はそれぞれ独立して、

- 5 (1) 水素原子、
- (2) C 1～8アルキル基、
- (3) C 2～8アルケニル基、
- (4) C 2～8アルキニル基、
- (5) $-\text{COOR}^{120}$ 、
- 10 (6) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、
- (7) C y c 4、または
- (8) 任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)ニトリル基、(c) C y c 4、(d) $-\text{COOR}^{120}$ 、(e) $-\text{CONR}^{121}\text{R}^{122}$ 、(f) $-\text{OR}^{123}$ 、(g) $-\text{SR}^{124}$ 、(h) $-\text{NR}^{125}\text{R}^{126}$ 、(i) $-\text{NR}^{127}\text{COR}^{128}$ 、(j) $-\text{SO}_2\text{NR}^{129}\text{R}^{130}$ 、(k) $-\text{OCOR}^{131}$ 、(l) $-\text{NR}^{132}\text{SO}_2\text{R}^{133}$ 、(m) $-\text{NR}^{134}\text{COOR}^{135}$ 、(n) $-\text{NR}^{136}\text{CONR}^{137}\text{R}^{138}$ 、(o) $-\text{S}-\text{SR}^{139}$ 、(p) $-\text{NHC}(\text{=NH})\text{NHR}^{140}$ 、(q)ケト基、(r) $-\text{NR}^{145}\text{CONR}^{146}\text{COR}^{147}$ 、(s) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{133})_2$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、またはC 2～8アルキニル基を表わし、
- 20 (基中、 $R^{120}\sim R^{130}$ 、 R^{132} 、 R^{134} 、 $R^{136}\sim R^{138}$ 、 R^{145} および R^{146} はそれぞれ独立して、1)水素原子、2)C 1～8アルキル基、3)C 2～8アルケニル基、4)C 2～8アルキニル基、5)C y c 4、または6)C y c 4、ハロゲン原子、 $-\text{OR}^{148}$ 、 $-\text{SR}^{149}$ 、 $-\text{COOR}^{150}$ 、または $-\text{NHCOR}^{141}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基を表わすか、
- 25 R^{121} と R^{122} 、 R^{129} と R^{130} 、 R^{137} と R^{138} は一緒になって、1)C 2～6

- アルキレン基、2) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - O - (C 2 ~ 6 アルキレン基) -、3) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - S - (C 2 ~ 6 アルキレン基) -、または 4) - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - NR²⁰² - (C 2 ~ 6 アルキレン基) - を表わし (基中、R²⁰²は、水素原子、C 1 ~ 8 アルキル基、フェニル基、
- 5 フェニル基によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基を表わす。)、
- R¹³¹、R¹³³、R¹³⁵、R¹³⁹ および R¹⁴⁷ はそれぞれ独立して、1) C 1 ~ 8 アルキル基、2) C 2 ~ 8 アルケニル基、3) C 2 ~ 8 アルキニル基、4) Cyc 4、または 5) Cyc 4、ハロゲン原子、-OR¹⁴⁸、-SR¹⁴⁹、-COOR¹⁵⁰、または -NHCO R¹⁴¹ によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基、C 2
- 10 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、
- R¹⁴⁰ は、水素原子、-COOR¹⁴²、または -SO₂R¹⁴³ を表わし、
- (基中、R¹⁴¹ ~ R¹⁴³ はそれぞれ独立して、1) C 1 ~ 8 アルキル基、2) C 2 ~ 8 アルケニル基、3) C 2 ~ 8 アルキニル基、4) Cyc 4、または 5) Cyc 4 によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~
- 15 8 アルキニル基を表わし、
- R¹⁴⁸ ~ R¹⁵⁰ はそれぞれ独立して、1) 水素原子、2) C 1 ~ 8 アルキル基、3) C 2 ~ 8 アルケニル基、4) C 2 ~ 8 アルキニル基、5) Cyc 4、または 6) Cyc 4 によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基、C 2 ~ 8 アルケニル基、C 2 ~ 8 アルキニル基を表わし、
- 20 Cyc 4 は Cyc 1 と同じ意味を表わす。
- ただし、Cyc 4 は 1 ~ 5 個の R¹⁴⁴ によって置換されていてもよく、R¹⁴⁴ は R⁵¹ と同じ意味を表わす。) を表わすか
- R³ と R⁴ は一緒になって、



(基中、 R^{190} および R^{191} はそれぞれ独立して、 R^3 または R^4 と同じ意味を表わす。)を表わし、

R^5 は、

(1) 水素原子、

5 (2) $C_1 \sim 8$ アルキル基、

(3) Cyc_5 、または

(4) Cyc_5 によって置換された $C_1 \sim 8$ アルキル基を表わす。

(基中、 Cyc_5 は、 Cyc_1 と同じ意味を表わす。

ただし、 Cyc_5 は、1～5個の R^{160} によって置換されていてもよく、

10 R^{160} は、 R^{51} と同じ意味を表わす。)]

で示されるトリアザスピロ [5. 5] ウンデカン誘導体、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシドまたはそれらの非毒性塩、

ii) 一般式 (I) で示される化合物、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシド、またはそれらの非毒性塩の製造方法、

15 iii) 一般式 (I) で示される化合物、それらの四級アンモニウム塩、それらのN-オキシド、またはそれらの非毒性塩を有効成分として含有する薬剤に関する。

本発明において、 $C_1 \sim 18$ アルキル基とは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル、ノニル、デシル、ウン
20 デシル、ドデシル、トリデシル、テトラデシル、ペンタデシル、ヘキサデシル、ヘプタデシル、オクタデシル基およびそれらの異性体を表わす。

$C_2 \sim 18$ アルケニル基とは、二重結合を1～9個 (好ましくは1～4個) 有してもよい $C_2 \sim 18$ アルキレン基を意味する。例えば、ビニル、プロペ
25 ニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ノネニル、デセニル、ウンデセニル、ドデセニル、トリデセニル、テトラデセニル、ペンタデセニル、ヘキサデセニル、ヘプタデセニル、オクタデセニル、

- ブタジエニル、ペンタジエニル、ヘキサジエニル、ヘプタジエニル、オクタジエニル、ノナジエニル、デカジエニル、ウンデカジエニル、ドデカジエニル、トリデカジエニル、テトラデカジエニル、ペンタデカジエニル、ヘキサデカジエニル、ヘプタデカジエニル、オクタデカジエニル、ヘキサトリエニル、ヘプタトリエニル、オクタトリエニル、ノナトリエニル、デカトリエニル、ウンデカトリエニル、ドデカトリエニル、トリデカトリエニル、テトラデカトリエニル、ペンタデカトリエニル、ヘキサデカトリエニル、ヘプタデカトリエニル、オクタデカトリエニル基およびこれらの異性体基等が挙げられる。
- 5
- 10 C 2～18アルキニル基とは、三重結合を1～9個（好ましくは1～4個）有してもよいC 2～18アルキレン基を意味する。例えば、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ノニニル、デシニル、ウンデシニル、ドデシニル、トリデシニル、テトラデシニル、ペンタデシニル、ヘキサデシニル、ヘプタデシニル、オクタデシニル、
- 15 ブタジイニル、ペンタジイニル、ヘキサジイニル、ヘプタジイニル、オクタジイニル、ノナジイニル、デカジイニル、ウンデカジイニル、ドデカジイニル、トリデカジイニル、テトラデカジイニル、ペンタデカジイニル、ヘキサデカジイニル、ヘプタデカジイニル、オクタデカジイニル、ヘキサトリイニル、ヘプタトリイニル、オクタトリイニル、ノナトリイニル、デカトリイニル、ウンデカトリイニル、ドデカトリイニル、トリデカトリイニル、テトラデカトリイニル、ペンタデカトリイニル、ヘキサデカトリイニル、ヘプタデカトリイニル、オクタデカトリイニル基およびこれらの異性体基等が挙げられる。
- 20
- ハロゲン原子とは、塩素、臭素、フッ素、ヨウ素原子が挙げられる。
- 25 C 1～8アルキル基とは、メチル、エチル、プロピル、ブチル、ペンチル、ヘキシル、ヘプチル、オクチル基およびそれらの異性体を表わす。

C 2～8 アルケニル基とは、二重結合を1～4個有してもよいC 2～8 アルキレン基を意味する。例えば、ビニル、プロペニル、ブテニル、ペンテニル、ヘキセニル、ヘプテニル、オクテニル、ブタジエニル、ペンタジエニル、ヘキサジエニル、ヘプタジエニル、オクタジエニル、ヘキサトリエニル、ヘ
5 プタトリエニル、オクタトリエニル基およびこれらの異性体基等が挙げられる。

C 2～8 アルキニル基とは、三重結合を1～4個有してもよいC 2～8 アルキレン基を意味する。例えば、例えば、エチニル、プロピニル、ブチニル、ペンチニル、ヘキシニル、ヘプチニル、オクチニル、ブタジイニル、ペンタ
10 ジイニル、ヘキサジイニル、ヘプタジイニル、オクタジイニル、ヘキサトリイニル、ヘプタトリイニル、オクタトリイニル基およびこれらの異性体基等が挙げられる。

C 2～6 アルキレン基とは、メチレン、エチレン、トリメチレン、テトラ
メチレン、ペンタメチレン、ヘキサメチレン基およびこれらの異性体基等が
15 挙げられる。

C 3～15 の単環、二環、または三環式（縮合またはスピロ）炭素環とは、
例えば、シクロプロパン、シクロブタン、シクロペンタン、シクロヘキサン、
シクロヘプタン、シクロオクタン、シクロペンテン、シクロヘキセン、シク
ロヘプテン、シクロオクテン、シクロペンタジエン、シクロヘキサジエン、
20 シクロヘプタジエン、シクロオクタジエン、ベンゼン、インデン、ナフタレ
ン、インダン、テトラヒドロナフタレン、ビスクロ [3. 3. 0] オクタン、
ビスクロ [4. 3. 0] ノナン、ビスクロ [4. 4. 0] デカン、スピロ [4.
4] ノナン、スピロ [4. 5] デカン、スピロ [5. 5] ウンデカン、ビスク
ロ [3. 1. 1] ヘプタン、ビスクロ [3. 3. 1] -2-ヘプテン、フ
25 ルオレン、アントラセン等が挙げられる。

1～4個の窒素原子、1～3個の酸素原子および／または1～3個の硫黄

原子を含む 3 ～ 15 員の単環、二環、または三環式（縮合またはスピロ）複素環とは、例えば、1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 3 個の酸素原子および／または 1 ～ 3 個の硫黄原子を含む 3 ～ 15 員の単環、二環、または三環式（縮合またはスピロ）複素環アリール、またはその一部または全部が飽和したものである。

1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 3 個の酸素原子および／または 1 ～ 3 個の硫黄原子を含む 3 ～ 15 員の単環、二環、または三環式（縮合またはスピロ）複素環アリールとしては、ピロール、イミダゾール、トリアゾール、テトラゾール、ピラゾール、ピリジン、ピラジン、ピリミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラン、オキセピン、チオフエン、チアイン（チオピラン）、チエピン、オキサゾール、イソオキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、フラザン、オキサジアゾール、オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアジアゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン、インドール、イソインドール、ベンゾフラン、イソベンゾフラン、ベンゾチオフエン、イソベンゾチオフエン、インダゾール、キノリン、イソキノリン、フタラジン、ナフチリジン、キノキサリン、キナゾリン、シンノリン、ベンゾオキサゾール、ベンゾチアゾール、ベンゾイミダゾール、ベンゾオキセピン、ベンゾオキサアゼピン、ベンゾオキサジアゼピン、ベンゾチエピン、ベンゾチアアゼピン、ベンゾチアジアゼピン、ベンゾアゼピン、ベンゾジアゼピン、ベンゾフラザン、ベンゾチアジアゾール、ベンゾトリアゾール、カルバゾール、アクリジン、ジベンゾフラン、ジベンゾチオフエン環等が挙げられる。

前記した 1 ～ 4 個の窒素原子、1 ～ 3 個の酸素原子および／または 1 ～ 3 個の硫黄原子を含む 3 ～ 15 員の単環、二環、または三環式（縮合またはスピロ）複素環で、一部または全部飽和したものとしては、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラゾリン、ピラ

ゾリジン、トリアゾリン、トリアゾリジン、テトラゾリン、テトラゾリジン、
ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ピペリジン、ジヒドロピラジン、
テトロヒドロピラジン、ピペラジン、ジヒドロピリミジン、テトラヒドロピ
5 リミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テトラヒドロピリ
ダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラヒドロアゼピン、
パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロジアゼピン、パー
ヒドロジアゼピン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、ジヒドロピラン、
テトラヒドロピラン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロチオフェン、ジヒ
10 ドロチアイン（ジヒドロチオピラン）、テトラヒドロチアイン（テトラヒド
ロチオピラン）、ジヒドロオキサゾール、テトラヒドロオキサゾール、ジヒ
ドロイソオキサゾール、テトラヒドロイソオキサゾール、ジヒドロチアゾー
ル、テトラヒドロチアゾール、ジヒドロイソチアゾール、テトラヒドロイソ
チアゾール、ジヒドロオキサジアゾール、テトラヒドロオキサジアゾール、
15 ジヒドロチオジアゾール、テトラヒドロチオジアゾール、テトラヒドロオキ
サジアジン、テトラヒドロチアジアジン、テトラヒドロオキサアゼピン、テ
トラヒドロオキサジアゼピン、パーヒドロオキサアゼピン、パーヒドロオキ
サジアゼピン、テトラヒドロチアアゼピン、テトラヒドロチアジアゼピン、
パーヒドロチアアゼピン、パーヒドロチアジアゼピン、モルホリン、チオモ
ルホリン、インドリン、イソインドリン、ジヒドロベンゾフラン、パーヒド
20 ロベンゾフラン、ジヒドロイソベンゾフラン、パーヒドロイソベンゾフラン、
ジヒドロベンゾチオフェン、パーヒドロベンゾチオフェン、ジヒドロイソベ
ンゾチオフェン、パーヒドロイソベンゾチオフェン、ジヒドロインダゾール、
パーヒドロインダゾール、ジヒドロキノリン、テトラヒドロキノリン、パー
ヒドロキノリン、ジヒドロイソキノリン、テトラヒドロイソキノリン、パー
25 ヒドロイソキノリン、ジヒドロフタラジン、テトラヒドロフタラジン、パー
ヒドロフタラジン、ジヒドロナフチリジン、テトラヒドロナフチリジン、パ

- ーヒドロナフチリジン、ジヒドロキノキサリン、テトラヒドロキノキサリン、
 パーヒドロキノキサリン、ジヒドロキナゾリン、テトラヒドロキナゾリン、
 パーヒドロキナゾリン、ジヒドロシンノリン、テトラヒドロシンノリン、パ
 ーヒドロシンノリン、ジヒドロベンゾオキサゾール、パーヒドロベンゾオキ
 5 サゾール、ジヒドロベンゾチアゾール、パーヒドロベンゾチアゾール、ジヒ
 ドロベンゾイミダゾール、パーヒドロベンゾイミダゾール、ジヒドロカルバ
 ザール、テトラヒドロカルバゾール、パーヒドロカルバゾール、ジヒドロア
 クリジン、テトラヒドロアクリジン、パーヒドロアクリジン、ジヒドロジベ
 ンゾフラン、ジヒドロジベンゾチオフェン、テトラヒドロジベンゾフラン、
 10 テトラヒドロジベンゾチオフェン、パーヒドロジベンゾフラン、パーヒドロ
 ジベンゾチオフェン、ジオキサラン、ジオキサン、ジチオラン、ジチアン、
 ベンゾジオキサラン、ベンゾジオキサン、ベンゾジチオラン、ベンゾジチア
 ン、2, 4, 6-トリオキサスピロ [3. 3. 0] オクタン-3,
 1'-シクロヘキサン]、1, 3-ジオキサラノ [4, 5-g] クロメン、
 15 2-オキサビシクロ [2. 2. 1] ヘプタン環等が挙げられる。

- C 3～8の単環式炭素環とは、例えば、シクロプロパン、シクロブタン、
 シクロペンタン、シクロヘキサン、シクロヘプタン、シクロオクタン、シク
 ロペンテン、シクロヘキセン、シクロヘプテン、シクロオクテン、シクロペ
 ンタジエン、シクロヘキサジエン、シクロヘプタジエン、シクロオクタジエ
 20 ン、ベンゼン等が挙げられる。

- 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄
 原子を含む3～8員の単環式複素環とは、例えば、1～4個の窒素原子、1
 ～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄原子を含む3～8員の単環
 式複素環アリール、またはその一部または全部が飽和したものである。
 25 1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2個の硫黄
 原子を含む3～8員の単環式複素環アリールとしては、ピロール、イミダゾ

ール、トリアゾール、テトラゾール、ピラゾール、ピリジン、ピラジン、ピ
リミジン、ピリダジン、アゼピン、ジアゼピン、フラン、ピラン、オキセピ
ン、チオフェン、チアイン（チオピラン）、チエピン、オキサゾール、イソ
オキサゾール、チアゾール、イソチアゾール、フラザン、オキサジアゾール、
5 オキサジン、オキサジアジン、オキサゼピン、オキサジアゼピン、チアジ
アゾール、チアジン、チアジアジン、チアゼピン、チアジアゼピン環等が挙げ
られる。

前記した1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～2
個の硫黄原子を含む3～8員の単環式複素環で、一部または全部飽和したも
10 のとしては、ピロリン、ピロリジン、イミダゾリン、イミダゾリジン、ピラ
ゾリン、ピラゾリジン、トリアゾリン、トリアゾリジン、テトラゾリン、テ
トラゾリジン、ジヒドロピリジン、テトラヒドロピリジン、ピペリジン、ジ
ヒドロピラジン、テトロヒドロピラジン、ピペラジン、ジヒドロピリミジン、
テトラヒドロピリミジン、パーヒドロピリミジン、ジヒドロピリダジン、テ
15 トラヒドロピリダジン、パーヒドロピリダジン、ジヒドロアゼピン、テトラ
ヒドロアゼピン、パーヒドロアゼピン、ジヒドロジアゼピン、テトラヒドロ
ジアゼピン、パーヒドロジアゼピン、ジヒドロフラン、テトラヒドロフラン、
ジヒドロピラン、テトラヒドロピラン、ジヒドロチオフェン、テトラヒドロ
チオフェン、ジヒドロチアイン（ジヒドロチオピラン）、テトラヒドロチア
20 イン（テトラヒドロチオピラン）、ジヒドロオキサゾール、テトラヒドロオ
キサゾール、ジヒドロイソオキサゾール、テトラヒドロイソオキサゾール、
ジヒドロチアゾール、テトラヒドロチアゾール、ジヒドロイソチアゾール、
テトラヒドロイソチアゾール、ジヒドロオキサジアゾール、テトラヒドロオ
キサジアゾール、ジヒドロチオジアゾール、テトラヒドロチオジアゾール、
25 テトラヒドロオキサジアジン、テトラヒドロチアジアジン、テトラヒドロオ
キサアゼピン、テトラヒドロオキサジアゼピン、パーヒドロオキサアゼピン、

パーヒドロオキサジアゼピン、テトラヒドロチアアゼピン、テトラヒドロチア
アジアゼピン、パーヒドロチアアゼピン、パーヒドロチアアジアゼピン、モル
ホリン、チオモルホリン、ジオキサラン、ジオキサン、ジチオラン、ジチア
ン等が挙げられる。

- 5 本発明において、 R^1 基、 R^2 基、 R^3 基、 R^4 基、 R^5 基が表わすそれぞれの基はいずれも好ましい。

R^1 基としては、Cyc 1によって置換されたC 1～18アルキル基、Cyc
c 1によって置換されたC 2～18アルケニル基、またはCyc 1によって
置換されたC 2～18アルキニル基が好ましく、より好ましくは、Cyc 1
10 によって置換されたC 1～6アルキル基である。

Cyc 1としては、C 3～10の単環または二環式（縮合またはスピロ）
炭素環または1～4個の窒素原子、1～2個の酸素原子および／または1～
2個の硫黄原子を含む3～10員の単環または二環式（縮合またはスピロ）
複素環が好ましく、より好ましくは、C 5～7の単環式炭素環アリールまた
15 は1～4個の窒素原子、2個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含
む5～10員の単環式または二環式複素環である。

具体的にCyc 1としては、ベンゼン環、ピラゾール環、イミダゾール環、
フラン環、チオフェン環、ベンゾジオキサン環、チアゾール環、キノリン環
が好ましい。

- 20 Cyc 1の置換基である R^{51} としては、Cyc 2、 $-OR^{52}$ 、 $-SR^{53}$ 、
 $-NR^{54}R^{55}$ が好ましい。 R^{52} 、 R^{53} 、 R^{54} 、 R^{55} としては、C 1～8ア
ルキル基、Cyc 2が好ましく、より好ましくは、メチル、エチル、プロピ
ル、フェニル基である。

Cyc 2としては、C 5～7の単環式炭素環アリールまたは1～4個の窒
25 素原子、1個の酸素原子および／または1個の硫黄原子を含む5～7員の単
環式複素環アリールが好ましく、より好ましくは、ベンゼン環である。

- Cyc 2の置換基である R^{77} としては、 $-\text{CONR}^{83}\text{R}^{84}$ 、 $-\text{NR}^{161}\text{COR}^{162}$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{163}\text{R}^{164}$ 、 $-\text{NR}^{166}\text{SO}_2\text{R}^{167}$ 、 $-\text{CONR}^{83}\text{R}^{84}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-\text{NR}^{161}\text{COR}^{162}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-\text{SO}_2\text{NR}^{163}\text{R}^{164}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-\text{NR}^{166}\text{SO}_2\text{R}^{167}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、が好ましい。 R^{83} 、 R^{84} 、 R^{161} 、 R^{162} 、 R^{163} 、 R^{164} 、 R^{166} および R^{167} としては、C 1～8アルキル基、Cyc 6、 $-\text{NR}^{176}\text{R}^{177}$ によって置換されたC 1～8アルキル基が好ましく、より好ましくは、メチル、エチル、プロピル、フェニル基、ジメチルアミノエチル基等である。
- 10 最も好ましい R^1 としては、フェニルエチル基、フェニルプロピル基、フェニルブチル基、フェニルペンチル基、フェニルヘキシル基、4-メトキシフェニルメチル基、4-プロピルオキシフェニルメチル基、4-フェニルオキシフェニルメチル基、3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル基、2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル基、5-エチルフラン-2-イルメチル基、5-エチルチオフェン-2-イルメチル基、3-クロロ-5-メチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル基、1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル基、4-(4-メチルスルホニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル基、4-(4-(2-ジメチルアミノエチルスルホニルアミノ)フェニルオキシ)フェニルメチル基、4-(4-ジメチルアミノスルホニルフェニルオキシ)フェニルメチル基、4-(4-メチルカルボニルアミノフェニルオキシ)フェニルメチル基、4-(4-(2-ジメチルアミノエチルカルボニルアミノ)フェニルオキシ)フェニルメチル基、4-(4-ジメチルアミノカルボニルフェニルオキシ)フェニルメチル基等が挙げられる。
- 20
- 25 R^2 としては、C 1～8アルキル基、C 2～8アルケニル基、C 2～8アルキニル基、Cyc 3によって置換されたC 1～8アルキル基が好ましい。よ

り好ましくは、C 1～4アルキル基、C 2～4アルケニル基、C 2～4アルキニル基である。

最も好ましい R^2 としては、エチル基、プロピル基、ブチル基、2-プロペニル基、2-ブテニル基、2-プロピニル基、フェニルメチル基、チオフェン-2-イルメチル基、2-ブチニル基等が挙げられる。

R^3 または R^4 としては、水素原子、C 1～8アルキル基、C y c 4によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-OR^{123}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、C y c 4と $-OR^{123}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-NR^{127}COR^{128}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-NR^{132}SO_2R^{133}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-NR^{134}COOR^{135}$ によって置換されたC 1～8アルキル基、 $-NR^{136}CONR^{137}R^{138}$ によって置換されたC 1～8アルキル基が好ましい。より好ましくは、C 1～4アルキル基、C y c 4によって置換されたC 1～4アルキル基、 $-OR^{123}$ によって置換されたC 1～4アルキル基、C y c 4と $-OR^{123}$ によって置換されたC 1～4アルキル基、 $-NR^{127}COR^{128}$ によって置換されたC 1～4アルキル基、 $-NR^{132}SO_2R^{133}$ によって置換されたC 1～4アルキル基、 $-NR^{134}COOR^{135}$ によって置換されたC 1～4アルキル基、 $-NR^{136}CONR^{137}R^{138}$ によって置換されたC 1～4アルキル基である。

C y c 4としては、ベンゼン環、シクロヘキサン環が好ましい。

R^{123} としては、水素原子、C 1～4アルキル基、C y c 4、またはC y c 4によって置換されたC 1～4アルキル基が好ましく、より好ましくは、水素原子、メチル基、エチル基、フェニル基、フェニルメチル基である。

R^{127} 、 R^{132} 、 R^{134} 、 R^{136} および R^{138} としては、水素原子またはメチル基が好ましい。

R^{128} 、 R^{133} 、 R^{135} 、 R^{137} としては、C y c 4またはC y c 4によって置換されたC 1～4アルキル基が好ましく、より好ましくは、フェニル基、

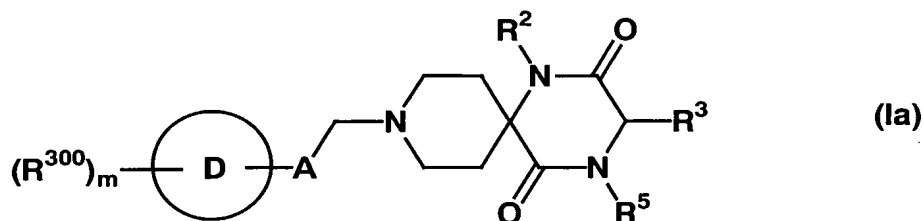
フェニルメチル基、フェニルエチル基である。

Cyc 4 の置換基である R¹⁴⁴ としては、C 1 ~ 4 アルキル基、ハロゲン原子、フェニル基、フェニルオキシ基が好ましく、より好ましくは、メチル基、フッ素原子、塩素原子、フェニル基、フェニルオキシ基である。

- 5 最も好ましい R³ または R⁴ としては、プロピル基、1-メチルプロピル基、2-メチルプロピル基、シクロヘキシルメチル基、1-ヒドロキシ-2-メチルプロピル基、1-ヒドロキシ-1-シクロヘキシルメチル基、3-(シクロペンチルエチルカルボニル) アミノブチル基、3-(ベンジルオキシカルボニル) アミノプロピル基、3-(フェニルカルボニル) アミノブチル基、
- 10 3-(フェニルメチルカルボニル) アミノブチル基、3-(フェニルエチルカルボニル) アミノブチル基、3-(フェニルエテニルカルボニル) アミノブチル基、3-(4-フェニルフェニルカルボニル) アミノブチル基、3-(4-フェニルオキシフェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、3-(4-クロロフェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、3-(4-フルオロ
- 15 フェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、3-(フェニルメチルアミノカルボニル) アミノブチル基、3-(4-トリフルオロメチルスルホニル) アミノブチル基、4-(シクロペンチルエチルカルボニル) アミノブチル基、4-(ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル基、4-(フェニルカルボニル) アミノブチル基、4-(フェニルメチルカルボニル) アミノブチル基、
- 20 4-(フェニルエチルカルボニル) アミノブチル基、4-(フェニルエテニルカルボニル) アミノブチル基、4-(4-フェニルフェニルカルボニル) アミノブチル基、4-(4-フェニルオキシフェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、4-(4-クロロフェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、4-(4-フルオロフェニルアミノカルボニル) アミノブチル基、4-
- 25 (フェニルメチルアミノカルボニル) アミノブチル基、4-(4-トリフルオロメチルスルホニル) アミノブチル基が挙げられる。

R⁵としては、水素原子またはメチル基が好ましい。

一般式 (I) で示される本発明化合物のうち、好ましい化合物としては、
一般式 (Ia)



5 (式中、R²はC 1～8 アルキル基を表わし、

R³はC 1～8 アルキル基またはC 3～7 シクロアルキル (C 1～4) アルキル基を表わし、

R⁵は水素原子またはC 1～8 アルキル基を表わし、

Aは単結合またはC 1～10 アルキレン基を表わし、

10 D環はC 3～10 の単環または二環式 (縮合またはスピロ) 炭素環または3～10 員の単環または二環式 (縮合またはスピロ) 複素環を表わし、

mは0 または1～4 の整数を表わし、

R³⁰⁰はC 1～4 アルキル基、C 1～4 アルコキシ基、フェニル基、フェノキシ基、またはベンジルオキシ基を表わす。)

15 で示される化合物が挙げられる。

D環が表わすC 3～10 の炭素環としては、C 3～10 の単環式または二環式炭素環が好ましく、より好ましくは、C 3～7 の単環式炭素環、またはC 8～10 の二環式炭素環である。

また、D環が表わす3～10 員の複素環としては、1～4 個の窒素原子、
20 1～2 個の酸素原子および/または1 個の硫黄原子を含む、3～10 員の単環式または二環式複素環アリール、またはその一部または全部が飽和したものが好ましい。より好ましくは、1～4 個の窒素原子、1～2 個の酸素原子および/または1 個の硫黄原子を含む、5～7 員の単環式アリール、8～1

0 員の二環式複素環アリールまたはその一部または全部が飽和したものである。

本発明においては、特に指示しない限り異性体はこれをすべて包含する。
例えば、アルキル基、アルコキシ基およびアルキレン基には直鎖のものおよび分枝鎖のものが含まれる。さらに、二重結合、環、縮合環における異性体
5 (E、Z、シス、トランス体)、不斉炭素の存在等による異性体(R、S体、 α 、 β 体、エナンチオマー、ジアステレオマー)、旋光性を有する光学活性体(D、L、d、l体)、クロマトグラフ分離による極性体(高極性体、低極性体)、平衡化合物、これらの任意の割合の混合物、ラセミ混合物は、す
10 べて本発明に含まれる。

[塩]

本発明においてはすべての非毒性塩を包含する。例えば、一般的な塩、酸付加塩、水和物塩等が挙げられる。

一般式(I)で示される本発明化合物は、公知の方法で相当する塩に変換
15 することができる。塩は毒性のない、水溶性のものが好ましい。適当な塩としては、アルカリ金属(カリウム、ナトリウム等)の塩、アルカリ土類金属(カルシウム、マグネシウム等)の塩、アンモニウム塩、薬学的に許容される有機アミン(テトラメチルアンモニウム、トリエチルアミン、メチルアミン、ジメチルアミン、シクロペンチルアミン、ベンジルアミン、フェネチル
20 アミン、ピペリジン、モノエタノールアミン、ジエタノールアミン、トリス(ヒドロキシメチル)アミン、リジン、アルギニン、N-メチル-D-グルカミン等)の塩が挙げられる。

一般式(I)で示される本発明化合物は、公知の方法で相当する酸付加塩に変換することができる。酸付加塩は毒性のない、水溶性のものが好ましい。
25 適当な酸付加塩としては、塩酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、リン酸塩、硝酸塩のような無機酸塩、または酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、乳酸塩、酒石酸

塩、シュウ酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、メタンスルホン酸塩、エタンスルホン酸塩、ベンゼンスルホン酸塩、トルエンスルホン酸塩、イセチオン酸塩、グルクロン酸塩、グルコン酸塩のような有機酸塩が挙げられる。

- 5 また、一般式（I）で示される本発明化合物またはその塩は、公知の方法により、水和物に変換することもできる。

一般式（I）で示される化合物またはそれらの非毒性塩はすべて好ましい。具体的には、実施例に記載した化合物またはそれらの非毒性塩が挙げられる。

- 一般式（I）で示される化合物の四級アンモニウム塩とは、一般式（I）
10 で示される化合物の窒素原子が、 R^0 基によって四級化されたものを表わす。

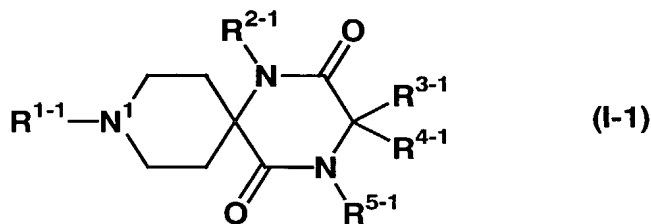
R^0 基は、C 1～8アルキル基、フェニル基によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。

一般式（I）で示される化合物のN-オキシドとは、一般式（I）で示される化合物の窒素原子が、酸化されたものを表わす。

- 15 [本発明化合物の製造方法]

一般式（I）で示される本発明化合物は、以下の方法または実施例に記載した方法で製造できる。

一般式（I）で示される本発明化合物のうち、窒素原子が四級アンモニウム塩またはN-オキシドを表わさない化合物、すなわち一般式（I-1）

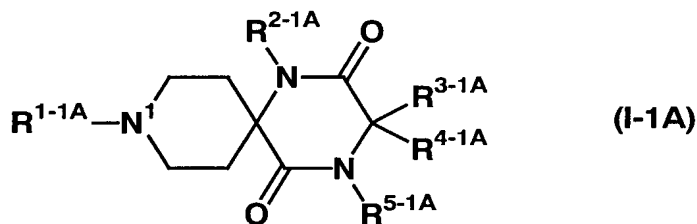


20

（式中、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 と同じ意味を表わし、 N^1 は、窒素原子を表わす。ただし、いずれの窒素原子も四級アンモニウム塩またはN-オキシドを表わさないものとする。）

で示される化合物は、以下に示した方法によって製造することができる。

一般式 (I-1) のうち、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} 基のいずれもカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わさない化合物、すなわち、一般式 (I-1A)

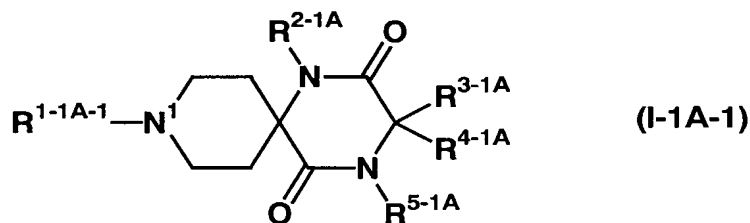


5

(式中、 R^{1-1A} 、 R^{2-1A} 、 R^{3-1A} 、 R^{4-1A} 、 R^{5-1A} は、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、いずれもカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わさないものとし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

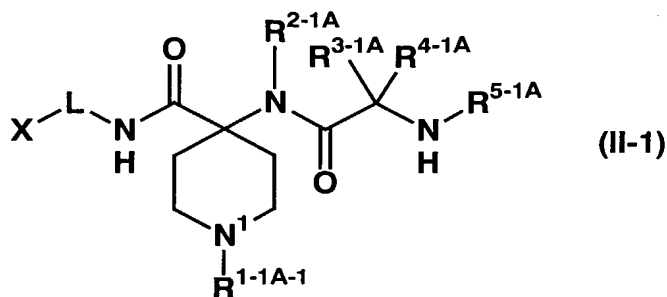
10 で示される化合物は、以下の方法によって製造することができる。

一般式 (I-1A) のうち、 R^1 が水素原子を表わさない化合物、すなわち、(I-1A-1)

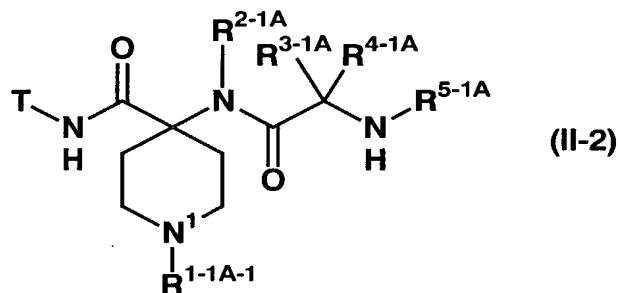


15 (式中、 R^{1-1A-1} は、 R^{1-1A} と同じ意味を表わす。ただし、 R^{1-1A-1} は水素原子を表わさないものとし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (II-1)



(式中、X-L-NH-は、末端アミノ基ポリスチレン樹脂の末端を表わし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)で示される化合物または一般式(II-2)



(式中、Tは、C 1～8アルキル基、C 3～8の単環式炭素環、またはC 3～8の単環式炭素環によって置換されたC 1～8アルキル基を表わす。)
で示される化合物を、環化反応に付すことにより製造することができる。

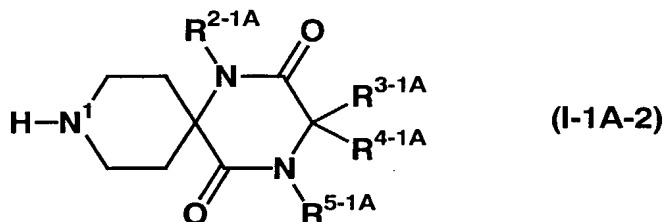
この一般式 (II-1) の環化方法は公知であり、例えば、有機溶媒（トルエン等）中、酸（酢酸、トリフルオロ酢酸、塩酸等）を用いて、60～120℃に加熱することにより行なわれる。この反応は、ポリスチレン樹脂の切断と同時に環化される反応である。

また必要であれば、この反応に引き続いて公知の方法によって、目的の非毒性塩に変換する操作を行なってもよい。

この一般式 (II-2) の環化方法は公知であり、例えば、有機溶媒（ジクロロエタン、トルエン等）中、三級アミン（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等）を用いて、60～120℃に加熱することにより行な

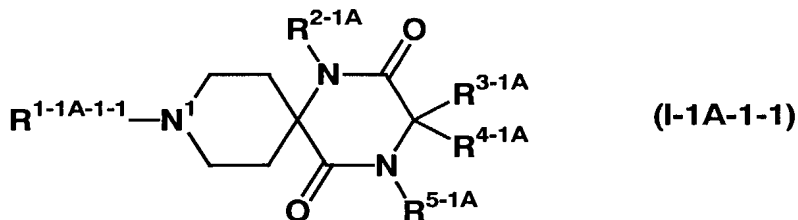
われる。この反応は、T基の切断と同時に環化される反応である。

一般式 (I-1A) のうち、 R^1 が水素原子を表わす化合物、すなわち (I-1A-2)



5 (式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、前記した方法によって製造した一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1A-1} 基がアミノ保護基を表わす化合物、すなわち (I-1A-1-1)



10 (式中、 $R^{1-1A-1-1}$ は、アミノ保護基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物をアミノ基の脱保護反応に付すことにより製造することができる。

15 アミノ基の保護基としては、例えばベンジル基、ベンジルオキシカルボニル基、アリルオキシカルボニル基、t-ブトキシカルボニル基、トリフルオロアセチル基等が挙げられる。

アミノ基の保護基としては、上記した以外にも容易にかつ選択的に脱離できる基であれば特に限定されない。例えば、T. W. Greene ら, Protective Groups in Organic Synthesis, Third Edition, Wiley-Interscience, New York, 1999 に記載さ

れたものが用いられる。

このアミノ基の脱保護反応は公知であり、例えば、

- (1) アルカリ加水分解、
- (2) 酸性条件下における脱保護反応、
- 5 (3) 加水素分解による脱保護反応、
- (4) 金属錯体を用いる脱保護反応、

これらの方法を具体的に説明すると、

- (1) アルカリ加水分解による脱保護反応（例えば、トリフルオロアセチル基）は、例えば、有機溶媒（メタノール、テトラヒドロフラン、ジオキサン等）中、アルカリ金属の水酸化物（水酸化ナトリウム、水酸化カリウム、水酸化リチウム等）、アルカリ土類金属の水酸化物（水酸化バリウム、水酸化カルシウム等）または炭酸塩（炭酸ナトリウム、炭酸カリウム等）あるいはその水溶液もしくはこれらの混合物を用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

- 15 (2) 酸条件下での脱保護反応（例えば、*t*-ブトキシカルボニル基）は、例えば、有機溶媒（ジクロロメタン、クロロホルム、ジオキサン、酢酸エチル、アニソール等）中、有機酸（酢酸、トリフルオロ酢酸、メタンスルホン酸等）、または無機酸（塩酸、硫酸等）もしくはこれらの混合物（臭化水素／酢酸等）中、0～100℃の温度で行なわれる。

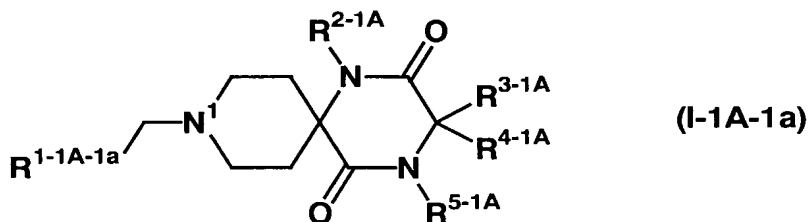
- 20 (3) 加水素分解による脱保護反応（例えば、ベンジル基、ベンジロキシカルボニル基、アリロキシカルボニル基）は、例えば、溶媒（エーテル系（テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメトキシエタン、ジエチルエーテル等）、アルコール系（メタノール、エタノール等）、ベンゼン系（ベンゼン、トルエン等）、ケトン系（アセトン、メチルエチルケトン等）、ニトリル系（アセトニトリル等）、アミド系（ジメチルホルムアミド等）、水、酢酸エチル、酢酸またはそれらの2以上の混合溶媒等）中、触媒（パラジウム
- 25

—炭素、パラジウム黒、水酸化パラジウム、酸化白金、ラネーニッケル等)の存在下、常圧または加圧下の水素雰囲気下またはギ酸アンモニウム存在下、0～200℃の温度で行なわれる。

(4) 金属錯体を用いる脱保護反応は、例えば、有機溶媒（ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン等）中、トラップ試薬（水素化トリブチルスズ、ジメドン等）および／または有機酸（酢酸等）の存在下、金属錯体（テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム(0)錯体等）を用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

また、一般式(I-1A-1)で示される化合物は、一般式(I-1A-2)で示される化合物を用いて、以下の(a)～(g)に示した方法によっても製造することができる。

(a) 一般式(I-1A-1)のうち、 R^{1A-1} が、C1～18アルキル基、C2～18アルケニル基、C2～18アルキニル基または種々の置換基によって置換されたC1～18アルキル基、C2～18アルケニル基、C2～18アルキニル基を表わし、かつ R^{1A-1} が N^1 原子と結合する場合—CH₂—を介して結合する化合物、すなわち一般式(I-1A-1a)



(式中、 $R^{1-1A-1a}$ は、C1～17アルキル基、C2～17アルケニル基、C2～17アルキニル基、または任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、(b)—CONR⁷R⁸、(c)—COOR⁹、(d)—OR¹⁴、(e)—SR¹⁵、(f)—NR¹⁶R¹⁷、(g)—NR¹⁸COR¹⁹、(h)—SO₂NR²⁰R²¹、(i)—OCO R²²、(j)—NR²³SO₂R²⁴、(k)—NR²⁵COOR²⁶、(l)—NR²⁷CON R²⁸R²⁹、(m)Cyc1、(n)ケト基、(o)—N(SO₂R²⁴)₂によって置換

されたC 1～1 7アルキル基、C 2～1 7アルケニル基またはC 2～1 7アルキニル基を表わす。ただし、 $R^{1-1A-1a}$ は、カルボキシ基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わさないものとし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

- 5 で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (III)



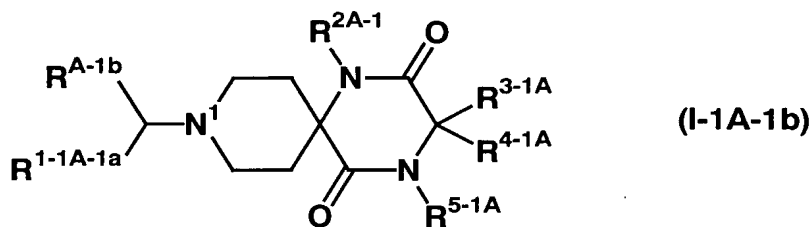
(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物を還元的アミノ化反応に付すことにより、製造することができる。

- 10 この還元的アミノ化反応は公知であり、例えば、有機溶媒 (例えば、ジクロロエタン、ジクロロメタン、ジメチルホルムアミド、酢酸およびこれらの混合物等) 中、還元剤 (水素化トリアセトキシホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム等) の存在下、0～4 0℃の温度で行なわれる。

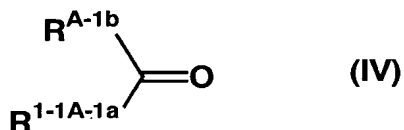
- 15 また、この還元的アミノ化反応は、 R^1 基中の窒素原子がN-オキシドを表わす化合物においても行なうことができる。

- (b) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1A-1} が、C 1～1 8アルキル基、C 2～1 8アルケニル基、C 2～1 8アルキニル基または種々の置換基によって置換されたC 1～1 8アルキル基、C 2～1 8アルケニル基、C 2～1 8アルキニル基を表わし、かつ R^{1A-1} がN¹原子と結合する場合-CHR^{A-1b}
20 - (基中、 R^{A-1b} は、C 1～1 7アルキル基、C 2～1 7アルケニル基、C 2～1 7アルキニル基を表わす。) を介して結合する化合物、すなわち一般式 (I-1A-1b)



(式中、 R^{A-1b} は、C 1～17アルキル基、C 2～17アルケニル基、C 2～17アルキニル基を表わし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (IV)



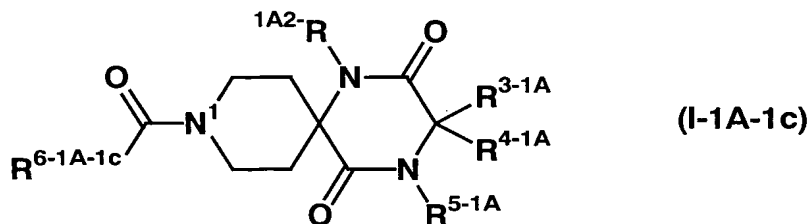
5

(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物を還元的アミノ化反応に付すことにより、製造することができる。

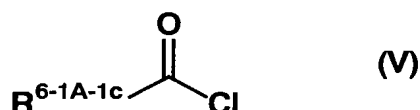
この還元的アミノ化反応は公知であり、例えば、有機溶媒（例えば、ジクロロエタン、ジクロロメタン、等）中、三級アミン（トリエチルアミン、ジイソプロピルエチルアミン等）の存在下、ルイス酸（四塩化チタン等）を用いて、0～40℃で反応させ、さらに、還元剤（水素化トリアセトキシホウ素ナトリウム、シアノ水素化ホウ素ナトリウム等）の存在下、0～40℃の温度で行なわれる。

15 (c) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1A-1} が、 COR^6 を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1c)



(式中、 $R^{6-1A-1c}$ は、 R^6 と同じ意味を表わす。ただし、 $R^{6-1A-1c}$ は、カルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わさないものとし、かついずれの窒素原子も四級アンモニウム塩またはN-オキシドを表わさないものとし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

- 5 示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (V)

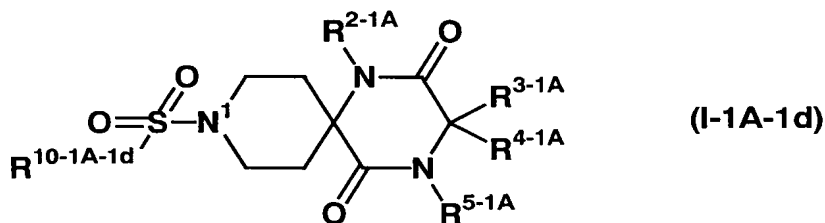


(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物をアミド化反応に付すことにより、製造することができる。

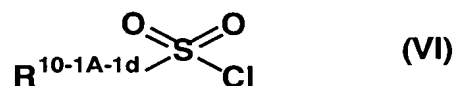
- このアミド化反応は公知であり、有機溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド等）中、三級アミン（イソプロピルエチルアミン、ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン等）もしくはアルカリ水溶液（重曹水または水酸化ナトリウム溶液等）の存在下、0～40℃で反応させることにより行なわれる。

- 15 (d) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} が、 SO_2R^{10} を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1d)



- (式中、 $R^{10-1A-1d}$ は、 R^{10} と同じ意味を表わす。ただし、カルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わさないものとし、かついずれの窒素原子も四級アンモニウム塩またはN-オキシドを表わさないものとし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (VI)

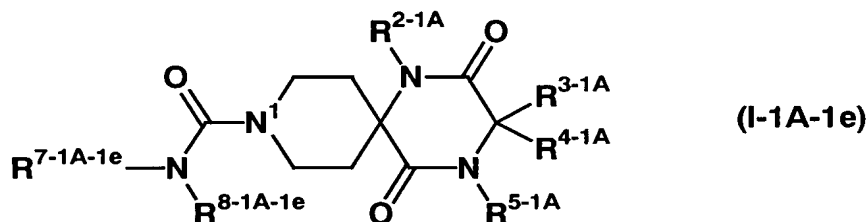


(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

5 5 6 7 8 9 10 11 12 13 14 15 16 17 18 19 20 21 22 23 24 25 26 27 28 29 30 31 32 33 34 35 36 37 38 39 40 41 42 43 44 45 46 47 48 49 50 51 52 53 54 55 56 57 58 59 60 61 62 63 64 65 66 67 68 69 70 71 72 73 74 75 76 77 78 79 80 81 82 83 84 85 86 87 88 89 90 91 92 93 94 95 96 97 98 99 100
で示される化合物をスルホンアミド化反応に付すことにより、製造することができる。

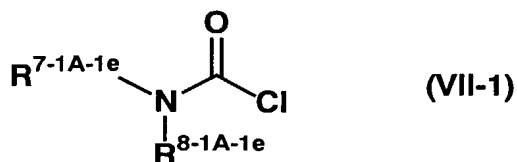
このスルホンアミド化反応は公知であり、不活性有機溶媒（クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等）中、三級アミン（ジイソプロピルエチルアミン、ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン等）の存在下、0～40℃で反応させることにより行なわれる。

(e) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1A-1} が、 CONR^7R^8 を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1e)



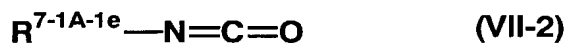
(式中、 $\text{R}^{7-1A-1e}$ および $\text{R}^{8-1A-1e}$ は、 R^7 および R^8 と同じ意味を表わす。ただし、いずれもカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含むする基を表わさないものとし、かついずれの窒素原子も四級アンモニウム塩またはN-オキシドを表わさないものとし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (VII-1)



(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物または、一般式 (VII-2)



5 (式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

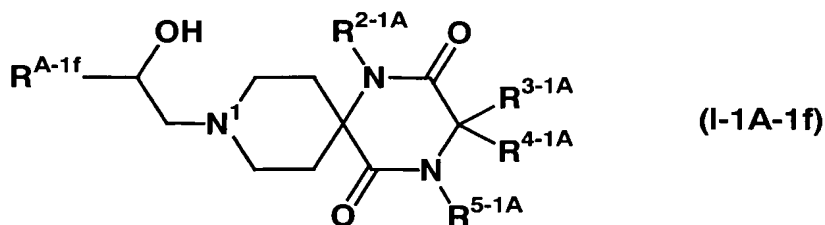
で示される化合物を反応させることにより、製造することができる。

この一般式 (VII-1) との反応は公知であり、有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、三級アミン (イソプロピルエチルアミン、ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン等) の存在下、0 ~ 40℃で反応させることにより行なわれる。

この一般式 (VII-2) との反応は公知であり、不活性有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジクロロエタン、ジメチルホルムアミド、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン等) 中、0 ~ 40℃で反応させることにより行なわれる。

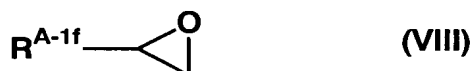
(f) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} が、 $-\text{CH}_2-\text{CH}(\text{OH})-\text{R}^{A-1f}$ (R^{A-1f} は、C1 ~ 16アルキル基、C2 ~ 16アルケニル基、C2 ~ 16アルキニル基または種々の置換基によって置換されたC1 ~ 16アルキル基、C2 ~ 16アルケニル基、C2 ~ 16アルキニル基を表わす。)

20 を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1f)



- (式中、 R^{A-1f} は、C 1～1 6 アルキル基、C 2～1 6 アルケニル基、C 2～1 6 アルキニル基または任意に選ばれた 1～4 個の (a) ハロゲン原子、(b) $-\text{CONR}^7\text{R}^8$ 、(c) $-\text{COOR}^9$ 、(d) $-\text{OR}^{14}$ 、(e) $-\text{SR}^{15}$ 、(f) $-\text{NR}^{16}\text{R}^{17}$ 、(g) $-\text{NR}^{18}\text{COR}^{19}$ 、(h) $-\text{SO}_2\text{NR}^{20}\text{R}^{21}$ 、(i) $-\text{OCOR}^{22}$ 、(j) $-\text{NR}^{23}\text{SO}_2\text{R}^{24}$ 、(k) $-\text{NR}^{25}\text{COOR}^{26}$ 、(l) $-\text{NR}^{27}\text{CONR}^{28}\text{R}^{29}$ 、(m) Cyc 1、(n) ケト基、(o) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{24})_2$ によって置換されたことによって置換された C 1～1 6 アルキル基、C 2～1 6 アルケニル基、C 2～1 6 アルキニル基を表わし、かついずれの窒素原子も四級アンモニウム塩または N-オキシドを表わさないものとし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

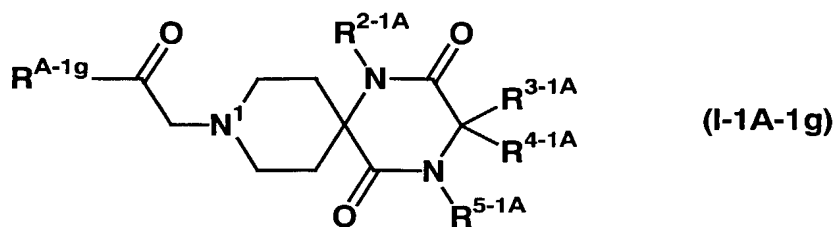
で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (VIII)



- (式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)
- 15 で示される化合物を反応させることにより、製造することができる。

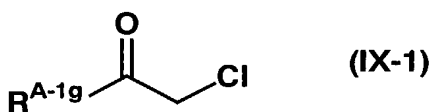
この反応は、公知であり、有機溶媒 (メタノール、エタノール、2-プロパノール、テトラヒドロフラン、アセトニトリル等) 中、三級アミン (トリエチルアミン、N-メチルモルホリン等) の存在下または非存在下で、40～100℃で反応させることにより行なわれる。

- 20 (g) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} が、 $-\text{CH}_2-\text{C}(=\text{O})-\text{R}^{A-1g}$ (R^{A-1g} は、 R^{A-1f} と同じ意味を表わす。) を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1g)



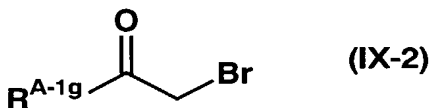
(式中、 R^{A-1g} は、 R^{A-1f} と同じ意味を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1A-2) で示される化合物と一般式 (IX-1)



(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物または、一般式 (IX-2)



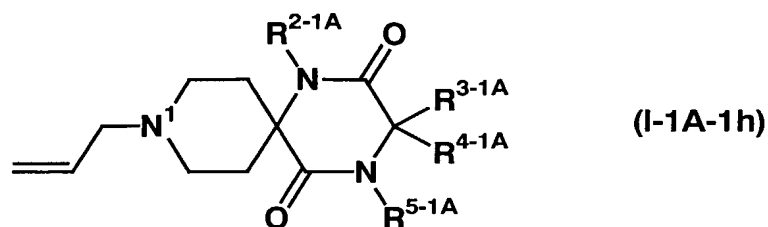
10 (式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物を反応させることにより、製造することができる。

これらの反応は公知であり、有機溶媒 (クロロホルム、ジクロロメタン、ジエチルエーテル、テトラヒドロフラン、ジオキサン、ジメチルホルムアミド等) 中、三級アミン (イソプロピルエチルアミン、ピリジン、トリエチルアミン、ジメチルアニリン、ジメチルアミノピリジン等) の存在下、0 ~ 40℃で反応させることにより行なわれる。

また、一般式 (I-1A-1) で示される化合物は、以下の (h) に示した方法によっても製造することができる。

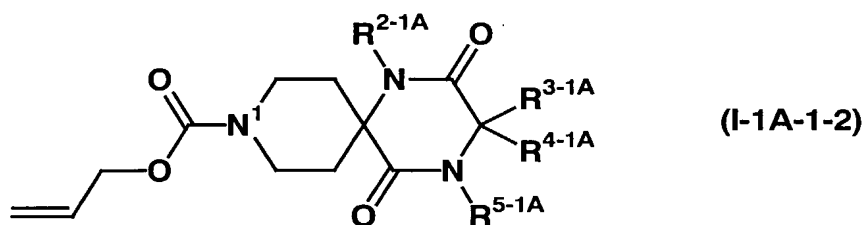
(h) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} が、2-プロペニル基 ($-CH_2CH=CH_2$) を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1h)



(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、前記した方法によって製造した一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} 基が2-プロペニルオキシカルボニル基 ($-COO-CH_2$

5 $CH=CH_2$) を表わす化合物、すなわち (I-1A-1-2)



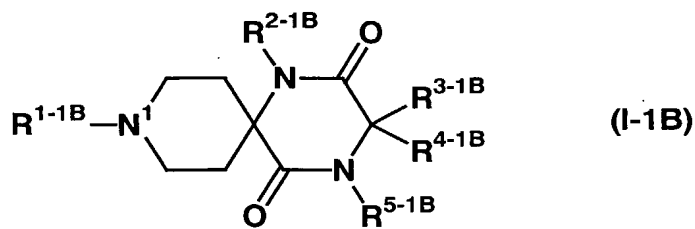
(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物を金属錯体を用いる反応に付すことにより、製造することができる。

10 この金属錯体を用いる反応は公知であり、例えば、有機溶媒 (テトラヒドロフラン、酢酸等) 中、金属錯体 (テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) 錯体等) を用いて、 $0 \sim 40^\circ C$ の温度で行なわれる。

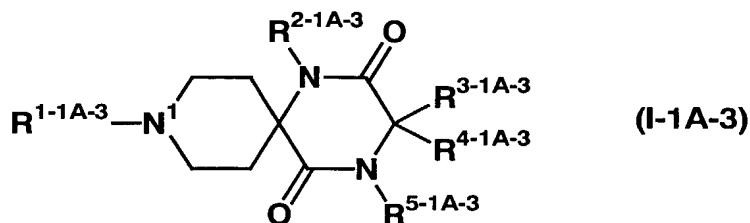
一般式 (I-1) のうち、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 基の少なくとも1つの基がカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を

15 表わす化合物、すなわち、一般式 (I-1B)



(式中、 R^{1-1B} 、 R^{2-1B} 、 R^{3-1B} 、 R^{4-1B} 、 R^{5-1B} は、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基がカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わし、他の記号は前記と同じ意味を表わす。)

- 5 で示される化合物は、前記した方法によって製造した一般式 (I-1A) のうち、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} の少なくとも1つの基が保護基によって保護されたカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わす化合物、すなわち、一般式 (I-1A-3)



- 10 (式中、 R^{1-1A-3} 、 R^{2-1A-3} 、 R^{3-1A-3} 、 R^{4-1A-3} 、 R^{5-1A-3} は、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基が保護基によって保護されたカルボキシル基、水酸基、アミノ基またはチオール基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)
- 15 で示される化合物を保護基の脱保護反応に付すことにより、製造することができる。

カルボキシル基の保護基としては、例えばメチル基、エチル基、*t*-ブチル基、ベンジル基、アリル基が挙げられる。

- 水酸基の保護基としては、例えばメトキシメチル基、2-テトラヒドロピラニル基、*t*-ブチルジメチルシリル基、*t*-ブチルジフェニルシリル基、
- 20 アセチル基、ベンジル基が挙げられる。

アミノ基の保護基としては、例えばベンジルオキシカルボニル基、アリルオキシカルボニル基、*t*-ブトキシカルボニル基、トリフルオロアセチル基、9-フルオレニルメトキシカルボニル基が挙げられる。

チオール基の保護基としては、例えばベンジル基、メトキシベンジル基、アセトアミドメチル基、トリフェニルメチル基、アセチル基が挙げられる。

- カルボキシ基、水酸基、アミノ基またはチオール基の保護基としては、上記した以外にも容易にかつ選択的に脱離できる基であれば特に限定されない。例えば、T. W. Greene ら, *Protective Groups in Organic Synthesis*, Third Edition, Wiley-Interscience, New York, 1999 に記載されたものが用いられる。

アミノ基の保護基の脱保護反応は、前記した方法によって行なわれる。

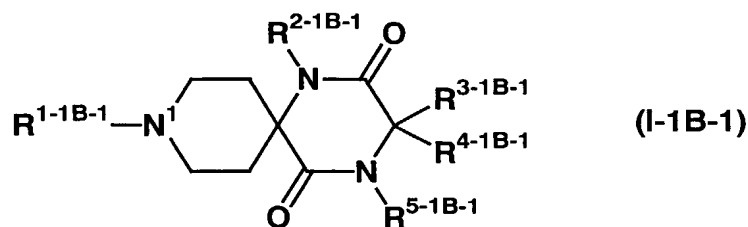
カルボキシ基、水酸基またはチオール基の保護基の脱保護反応は、よく知られており、例えば、

- 10 (1) アルカリ加水分解、
 - (2) 酸性条件下における脱保護反応、
 - (3) 加水素分解による脱保護反応、
 - (4) シリル基の脱保護反応、
 - (5) 金属錯体を用いる脱保護反応等が挙げられる。
- 15 これらの方法のうち、(1)、(2)、(3)、(5)は、前記したアミノ基の保護基の脱保護反応と同様の方法によって行なわれる。

(4) を具体的に説明すると、シリル基の脱保護反応は、例えば、有機溶媒（テトラヒドロフラン、アセトニトリル等）中、テトラブチルアンモニウムフルオリドを用いて、0～40℃の温度で行なわれる。

- 20 当業者には容易に理解できることではあるが、これらの脱保護反応を使い分けることにより、目的とする本発明化合物が容易に製造することができる。

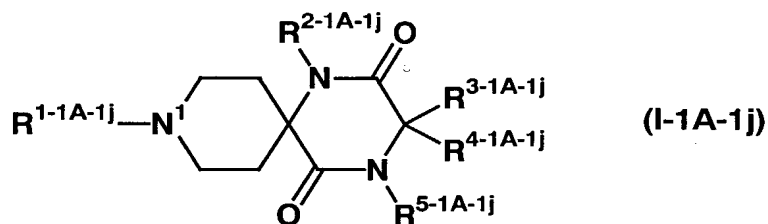
さらに、一般式（I-1A-1）で示される化合物は、一般式（I-1B-1）



(式中、 R^{1-1B-1} 、 R^{2-1B-1} 、 R^{3-1B-1} 、 R^{4-1B-1} 、 R^{5-1B-1} は、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基がアミノ基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

- 5 示される化合物を用いて、以下の(j)～(m)に示した方法によっても製造することができる。

(j) 一般式(I-1A-1)のうち、 R^{1-1A-1} 、 R^{2-1A} 、 R^{3-1A} 、 R^{4-1A} 、 R^{5-1A} の少なくとも1つの基がアミド基を含有する基を表わす化合物、すなわち一般式(I-1A-1j)



10

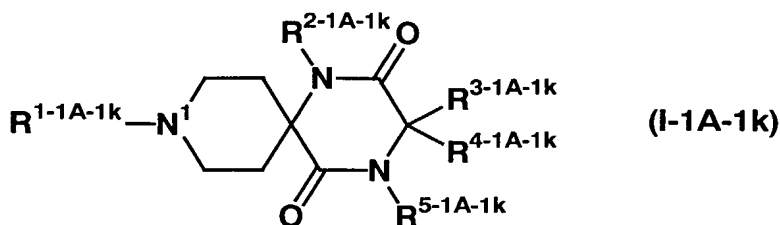
(式中、 $R^{1-1A-1j}$ 、 $R^{2-1A-1j}$ 、 $R^{3-1A-1j}$ 、 $R^{4-1A-1j}$ 、 $R^{5-1A-1j}$ は、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基がアミド基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

- 15 示される化合物は、一般式(I-1B-1)で示される化合物をアミド化反応に付すことにより、製造することができる。

このアミド化反応は、前記した方法によって、行うことができる。

(k) 一般式(I-1A-1)のうち、 R^{1-1A-1} 、 R^{2-1A} 、 R^{3-1A} 、 R^{4-1A} 、 R^{5-1A} の少なくとも1つの基がスルホンアミド基を含有する基を表わす化合物、すなわち一般式(I-1A-1k)

20

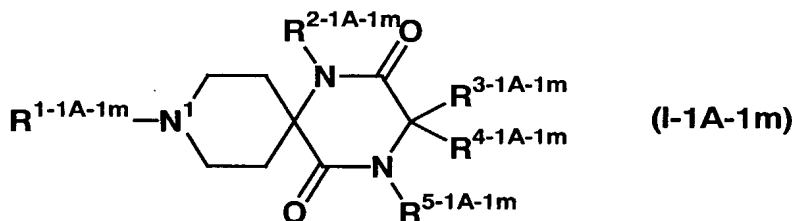


(式中、 $R^{1-1A-1k}$ 、 $R^{2-1A-1k}$ 、 $R^{3-1A-1k}$ 、 $R^{4-1A-1k}$ 、 $R^{5-1A-1k}$ は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基がスルホンアミド基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1B-1) で示される化合物をスルホンアミド化反応に付すことにより、製造することができる。

このスルホンアミド化反応は、前記した方法によって、行うことができる。

(m) 一般式 (I-1A-1) のうち、 R^{1-1A-1} 、 R^{2-1A} 、 R^{3-1A} 、 R^{4-1A} 、 R^{5-1A} の少なくとも1つの基がウレア基を含有する基を表わす化合物、すなわち一般式 (I-1A-1m)



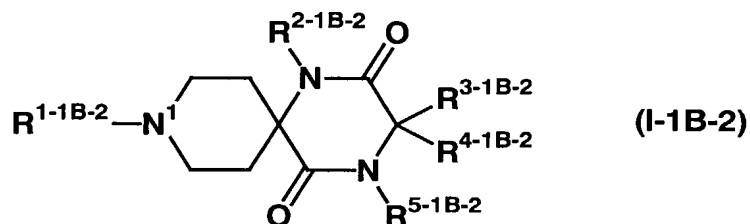
(式中、 $R^{1-1A-1m}$ 、 $R^{2-1A-1m}$ 、 $R^{3-1A-1m}$ 、 $R^{4-1A-1m}$ 、 $R^{5-1A-1m}$ は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 と同じ意味を表わす。ただし、少なくとも1つの基がウレア基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、一般式 (I-1B-1) で示される化合物をウレア化反応に付すことにより、製造することができる。

このウレア化反応は、前記した方法によって、行うことができる。

一般式 (I-1) のうち、 R^{1-1} 、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} 基の少な

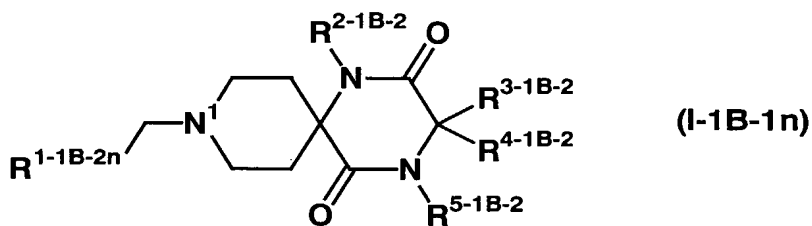
くとも1つの基が水酸基を含有する基を表わすかおよび／または R^1 がカルボキシ基を含有する基を表わす化合物、すなわち、一般式 (I-1B-2)



- (式中、 R^{1-1B-2} 、 R^{2-1B-2} 、 R^{3-1B-2} 、 R^{4-1B-2} 、 R^{5-1B-2} は、 R^{1-1} 、
 5 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} と同じ意味を表わす。ただし、 R^{1-1B-2} 、 R^{2-1B-2} 、 R^{3-1B-2} 、 R^{4-1B-2} 、 R^{5-1B-2} 基のうち少なくとも1つの基が水酸基を含有する基を表わすかおよび／または R^{1B-2} がカルボキシ基を含有する基を表わし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物は、以下の(n)の方法によっても製造することができる。

- 10 (n) 一般式 (I-1B-2) のうち、 R^{1-1B-2} が、C1～18アルキル基、C2～18アルケニル基、C2～18アルキニル基または種々の置換基によって置換されたC1～18アルキル基、C2～18アルケニル基、C2～18アルキニル基を表わし、かつ R^{1-1B-2} が N^1 原子と結合する場合 $-CH_2-$ を介して結合する化合物、すなわち一般式 (I-1B-1n)

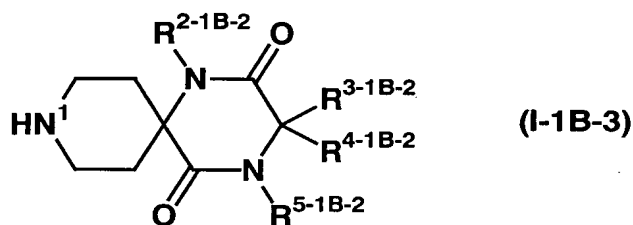


15

(式中、 $R^{1-1B-2n}$ は、C1～17アルキル基、C2～17アルケニル基、C2～17アルキニル基または任意に選ばれた1～5個の(a)ハロゲン原子、
 (b) $-CONR^7R^8$ 、(c) $-COOR^9$ 、(d) $-OR^{14}$ 、(e) $-SR^{15}$ 、(f) $-NR^{16}R^{17}$ 、(g) $-NR^{18}COR^{19}$ 、(h) $-SO_2NR^{20}R^{21}$ 、(i) $-OCOR^{22}$

- 2、(j) $-\text{NR}^{23}\text{SO}_2\text{R}^{24}$ 、(k) $-\text{NR}^{25}\text{COOR}^{26}$ 、(l) $-\text{NR}^{27}\text{CONR}^{28}\text{R}^{29}$ 、(m) Cyc 1、(n) ケト基、(o) $-\text{N}(\text{SO}_2\text{R}^{24})_2$ によって置換された C 1 ~ 17 アルキル基、C 2 ~ 17 アルケニル基または C 2 ~ 17 アルキニル基を表わす。ただし、 $\text{R}^{1-1\text{B}-2n}$ 、 $\text{R}^{2-1\text{B}-2}$ 、 $\text{R}^{3-1\text{B}-2}$ 、 $\text{R}^{4-1\text{B}-2}$ 、 $\text{R}^{5-1\text{B}-2}$ 基のうち少なくとも 1 つの基が水酸基を含有する基を表わすかおよび／または $\text{R}^{1\text{B}-2n}$ がカルボキシ基を含有する基を表わし、かついずれの窒素原子も四級アンモニウム塩または N-オキシドを表わさないものとし、他の記号は、前記と同じ意味を表わす。)

- 10 で示される化合物は、前記した方法によって製造した一般式 (I-1B) のうち、 R^1 が水素原子を表わし、 R^{2-1} 、 R^{3-1} 、 R^{4-1} 、 R^{5-1} のうち少なくとも 1 つの基が水酸基を含有する基を表わす化合物、すなわち、一般式 (I-1B-3)



(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

- 15 で示される化合物と一般式 (X)



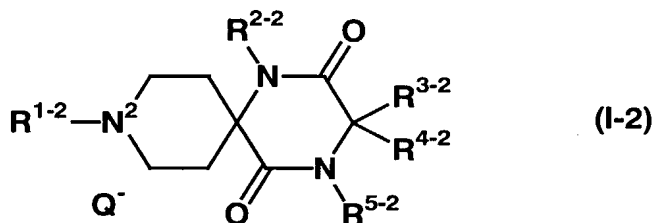
(式中、すべての記号は、前記と同じ意味を表わす。)

で示される化合物を還元的アミノ化反応に付すことにより、製造することができる。

- 20 この還元的アミノ化反応は、前記した方法によって、行なわれる。

また、この還元的アミノ化反応は、 R^1 基中の窒素原子が N-オキシドを表わす化合物においても行うことができる。

一般式 (I) で示される本発明化合物のうち、少なくとも 1 つの窒素原子が四級アンモニウム塩を表わす化合物、すなわち一般式 (I-2)



- (式中、 R^{1-2} 、 R^{2-2} 、 R^{3-2} 、 R^{4-2} 、 R^{5-2} は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 と同じ意味を表わし、 N^2 は、窒素原子を表わす。ただし、少なくとも 1 つの窒素原子が四級アンモニウム塩を表わすものとし、 Q は、ハロゲン原子を表わすものとする。)

で示される化合物は、一般式 (I-1) で示される化合物を一般式 (XI)

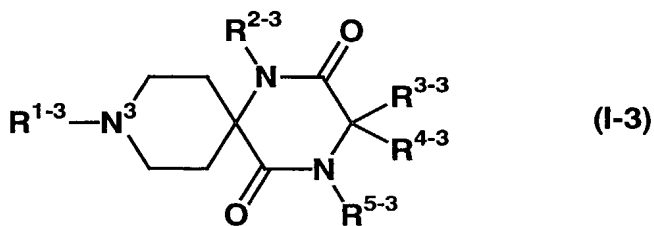


- (式中、 R^0 は、C 1 ~ 8 アルキル基またはフェニル基によって置換された C 1 ~ 8 アルキル基を表わし、 Q は、ハロゲン原子を表わす。)

で示される化合物を反応させることにより、製造することができる。

この反応は公知であり、例えば、有機溶媒 (アセトン、ジメチルホルムアミド、メチルエチルケトン等) 中、0 ~ 40 °C の温度で行なわれる。

- 一般式 (I) で示される本発明化合物のうち、少なくとも 1 つの窒素原子が N-オキシドを表わす化合物、すなわち一般式 (I-3)



(式中、 R^{1-3} 、 R^{2-3} 、 R^{3-3} 、 R^{4-3} 、 R^{5-3} は、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、

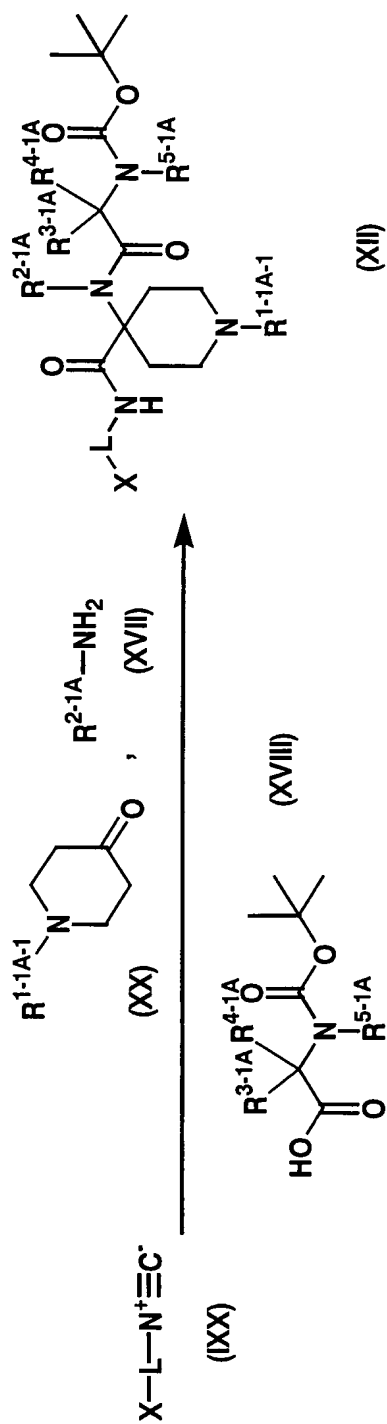
R^5 と同じ意味を表わし、 N^3 は、窒素原子を表わす。ただし、少なくとも1つの窒素原子がN-オキシドを表わすものとする。)

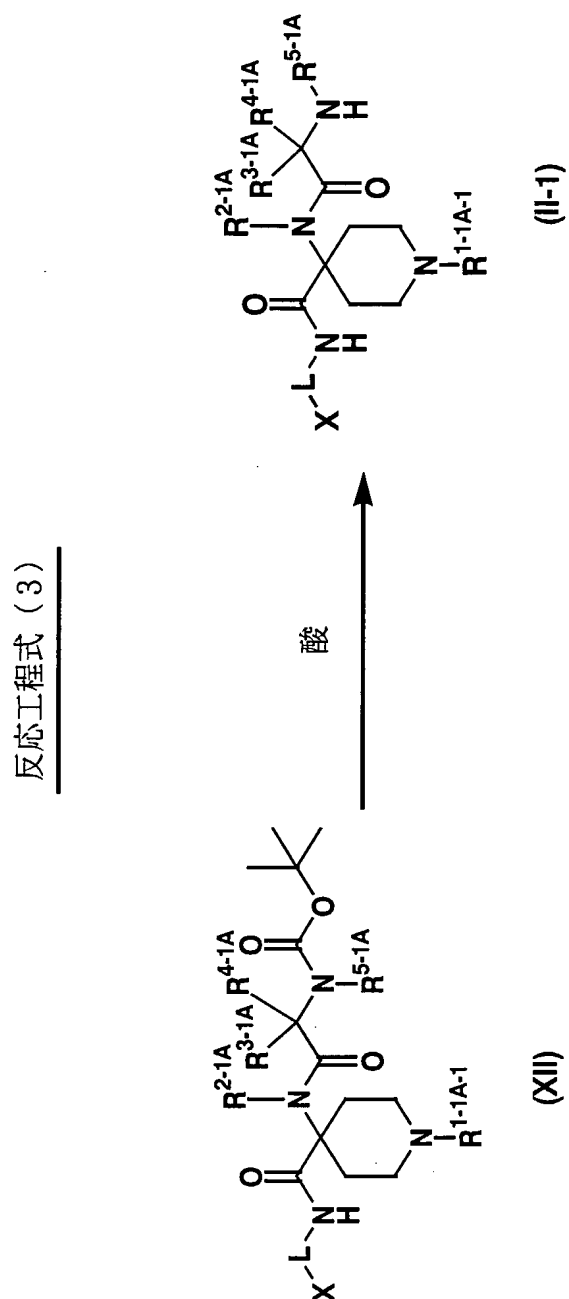
で示される化合物は、一般式(I-1)で示される化合物を酸化反応に付すことにより、製造することができる。

- 5 この酸化反応は公知であり、例えば、適当な有機溶媒（ジクロロメタン、クロロホルム、ベンゼン、ヘキサン、t-ブチルアルコール等）中で、過剰の酸化剤（過酸化水素、過ヨウ素酸ナトリウム、亜硝酸アシル、過ホウ酸ナトリウム、過酸（例えば、3-クロロ過安息香酸、過酢酸等）、オキシソ（商品名、以下、オキシソと略記する；ポタシウムパーオキシモノスルフェート）、
- 10 過マンガン酸カリウム、クロム酸等）の存在下、20～60℃の温度で反応させることにより行なわれる。

一般式(II-1)で示される化合物は、次に示す反応工程式1～3によって製造することができる。

反応工程式 (2)



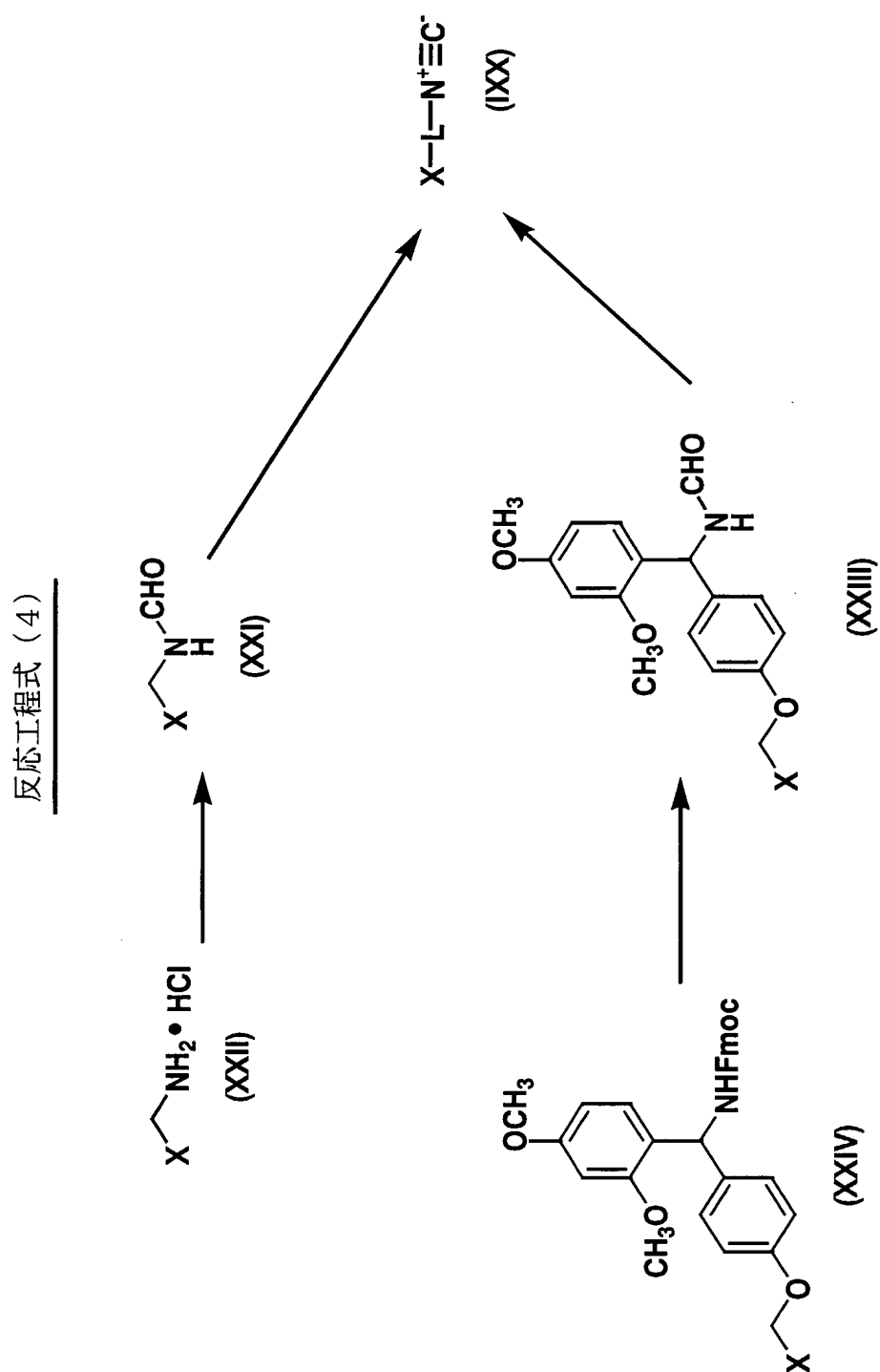


反応工程式中、Xはポリスチレン樹脂を表わし、Lは二価基を表わし、その他の記号は前記と同じ意味を表わす。

Lが表わす二価基とは、用いる樹脂によって異なるが、例えば、メチレン
 5 基、R i n k基が挙げられる。R i n k基とは、4-（2，4-ジメトキシ
 ベンジル）フェノキシメチル基を意味する。

本発明において、末端アミノ基ポリスチレン樹脂としては、例えば、アミノメチルポリスチレン樹脂、9-フルオレニルメチルオキシカルボニルアミノ-*R i n k*樹脂等が使用される。

次の反応工程式4に示すように、アミノメチルポリスチレン樹脂、9-フルオレニルメチルオキシカルボニルアミノ-*R i n k*樹脂を用いて、一般式
5 (XVI) で示される樹脂を製造することができる。



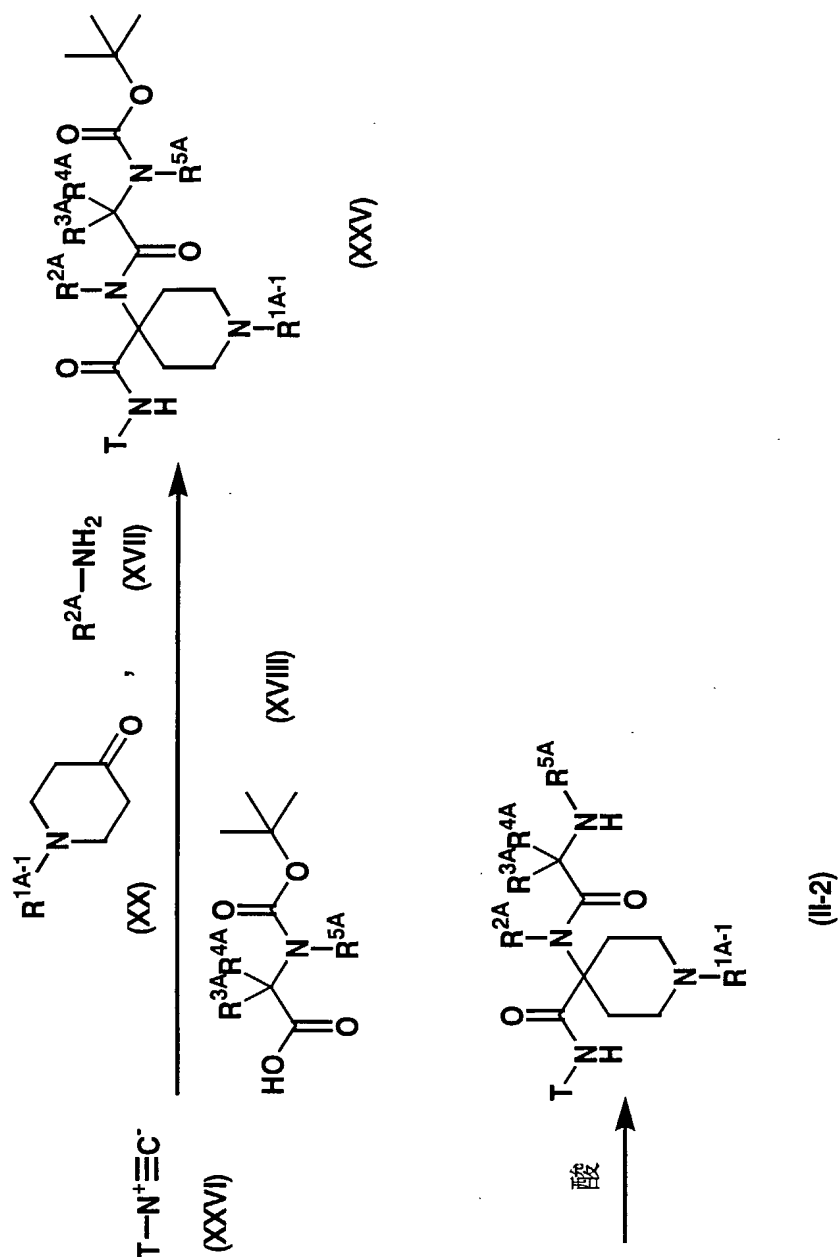
本発明中の、ポリスチレン樹脂を用いた反応においては、反応生成物は通常の精製手段、例えば、溶媒（ジメチルホルムアミド、ジクロロメタン、メタノール、テトラヒドロフラン、トルエン、酢酸／トルエン等）で、複数回

洗浄することにより精製することができる。また、最終反応の生成物は通常の精製手段、例えば、常圧下または減圧下における蒸留、シリカゲルまたはケイ酸マグネシウムを用いた高速液体クロマトグラフィー、薄層クロマトグラフィー、あるいはカラムクロマトグラフィーまたは洗浄、再結晶等の方法

5 により精製することができる。

また、一般式 (II-2) で示される化合物は、次に示す反応工程式 5 によって製造することができる。

反応工程式 (5)



本発明における出発物質および各試薬は、それ自体公知であるか、または公知の方法により製造することができる。

[薬理活性]

- 5 一般式 (I) で示される本発明化合物の有効性は、例えば、以下の実験によって証明された。

先述したように、HIVがCD4陽性細胞上の受容体であるCXCR4、

あるいはCCR5に結合することを阻害する化合物のスクリーニングをするためには、HIVウイルスを用いたアッセイ系で行うことがより直接的な手法である。しかし、HIVウイルスを大量スクリーニングに使用するには、その取り扱いの難しさから実用的ではない。一方、マクロファージ指向性(R5) HIV-1とRANTES、MIP-1 α 、MIP-1 β が共にCCR5に結合することから、HIV側とRANTES、MIP-1 α 、MIP-1 β 側双方のCCR5結合部位、並びにCCR5側のRANTES、MIP-1 α 、MIP-1 β およびHIV結合部位には、何らかの共通する特徴があるものと予測し得る。したがって、既存の抗AIDS薬(逆転写阻害剤やプロテアーゼ阻害)と異なる作用機序であるHIVウイルスの細胞への吸着を阻害する化合物を発見するため、HIVの代わりにCCR5の内因性リガンドであるRANTES、MIP-1 α 、MIP-1 β を用いたアッセイ系が利用可能である。

具体的には、RANTESとCCR5の結合を阻害する化合物をスクリーニングする系として、例えば、CCR5はG蛋白共役7回膜貫通型受容体であることから、RANTESがCCR5を介して誘導するCa²⁺イオンの、一過性上昇に対する効果を測定する系が実施可能である。T細胞指向性(X4) HIVと、SDF-1が共にCXCR4に結合することから、同様な考え方が可能である。

20 [実験方法]

(1) ヒトCCR5遺伝子の単離

ヒト胎盤cDNAは、Marathon cDNA amplification kit (Clontech) を用いて作製した。PCRプライマーであるhCCR5XbaI-F1: 5' -AGCTAGTCTAGATCCGTTCCCTACAAGAACTCTCC-3' (配列番号1) およびhCCR5XbaI-R1: 5' -AGCTAGTCTAGAGTGCACTCTGACTGGGTCACCA-3' (配列番号2) は、

GenBank U54994 の配列に基き設計した。

ヒト胎盤 cDNA を鋳型として、Ex Taq (Takara) を用いて、PCR 反応 (95℃で2分→[95℃で30秒、60℃で45秒、72度で1分]×35回) を行なった。増幅した PCR 産物を、1%アガロースゲル電気泳動後、

- 5 QIAquick Gel Extraction Kit (QIAGEN) を用いて精製し、制限酵素 XbaI で切断した。切断した断片を、発現ベクター pEF-BOS-bsr に DNA Ligation Kit Ver.2 (Takara) をもちいて連結し、大腸菌 DH5a に形質転換した。このプラスミド pEF-BOS-bsr/hCCR5 を調製し、DNA 配列を確認した。

(2) CHO細胞の培養

- 10 CHO-dhfr(-) は、Ham's F-12 (ウシ胎児血清 (10%)、ペニシリン (50 U/ml)、ストレプトマイシン (50 mg/ml) 含有) を用いて培養した。また、形質導入した細胞は、上記にブラストサイジン (5 mg/ml) を添加し、培養した。

(3) CHO細胞への形質導入

- 15 DMRIE-C reagent (Gibco BRL) を用いて、プラスミド pEF-BOS-bsr/hCCR5 を CHO-dhfr(-) 細胞に形質導入した。48時間後、5 mg/ml のブラストサイジンを含む培地に交換して選択を行ない、安定過剰発現細胞を樹立した。

(4) RANTES と CCR5 の結合 (RANTES の Ca イオン一過性上昇誘導活性) に対する阻害実験

- 20 樹立したヒト CCR5 安定過剰発現 CHO 細胞 (CCR5/CHO 細胞) を、Ham's F-12 培地および FBS (10%) に懸濁し、96穴プレートに 3.0×10^6 細胞/穴となるように巻き込んだ。37℃で1日培養した後、培養上清を除去して、Ham's F-12 培地 (Fura-2AM (5 μ M)、Probenecid (2.5mM) および HEPES (20mM; pH7.4) 含有) を 80 μ l/穴添加し、遮光
- 25 状態で、37℃で1時間インキュベートした。1×Hanks/HEPES (20mM; pH7.4) 溶液で2回洗浄した後、同溶液を 100 μ l/穴添加した。

この Fura-2AM を取り込んだ CCR5/CHO 細胞に対して、試験化合物を添加後 3 分経過時に、1×Hanks/HEPES (20 mM; pH 7.4) 溶液で希釈した組み換えヒト RANTES (PeproTech) を、最終濃度 10 nM 添加した。ヒト RANTES によって誘導される細胞内 Ca^{2+} 濃度の一過性上昇を、96 穴用 Ca^{2+} 検出器 (浜松ホトニクス) を用いて測定し、試験化合物の阻害率 (%) を以下の計算式により算出した。

$$\text{阻害率} = (E_c - E_a) / E_c \times 100$$

E_c : RANTES による Ca^{2+} 一過性上昇の測定値

E_a : 試験化合物を添加した時の RANTES による Ca^{2+} 一過性上昇の測定値

その結果、本発明化合物は、10 μ M で 50 % 以上の阻害を示した。例えば、実施例 2 (1) 化合物は、 IC_{50} 値が 0.05 μ M、実施例 2 (2) 化合物は、 IC_{50} 値が 0.05 μ M であった。

CCR5 指向性の HIV 株に対して吸着阻害効果を有する化合物を見出す系に関しては上述したが、この系を用いて CCR5 あるいはそのリガンドの作用を阻害する化合物も見出すことは当然可能である。同様にして、他のケモカイン受容体とそのリガンドの作用を阻害する化合物を見出すことが可能である。例えば、CCR2 あるいはそのリガンドの作用を阻害する化合物を見出す系も構築できる。CCR5 と同様に CCR2 は G 蛋白共役 7 回膜貫通型受容体であるので、そのリガンドである。例えば MCP-1 が CCR2 を介して誘導する Ca イオンの一過性上昇に対する効果を測定することで実施可能である。

(5) MCP-1 と CCR2 の結合 (MCP-1 の Ca イオン一過性上昇誘導活性) に対する阻害実験

ヒト CCR2 を発現している細胞、例えばヒト単球細胞株 THP-1

- (ATCC No.TIB-202) を F B S (1 0 %) 、 Fura2-AM (5 μ M) 、 Probenecid (2.5mM) および H E P E S (2 0 m M 、 p H 7.4) を含む RPMI1640 培地に 5.0×10^6 細胞 / m l となるように懸濁し、遮光した状態で、37℃で30分間保温した。4～8倍の 1 \times Hanks / H E P E S (2 0 m M 、 p H 7.4) /
- 5 Probenecid (2.5mM) を添加し、遮光した状態で、さらに37℃で30分間保温した。1 \times Hanks / H E P E S (2 0 m M 、 p H 7.4) / Probenecid (2.5mM) 溶液で細胞を洗浄した後、同溶液で 2.0×10^6 細胞 / m l に再懸濁し、96穴プレートに100 μ l 添加した。試験化合物溶液を添加後、3分経過時に
- 10 1 \times Hanks / H E P E S (2 0 m M 、 p H 7.4) / Probenecid (2.5mM) で希釈した組換えヒト MCP-1 (PeproTech) を最終濃度 30 n M 添加した。ヒト MCP-1 により誘導される細胞内 Ca^{2+} 濃度の一過性上昇を96穴用 Ca^{2+} 検出機 (浜松ホトニクス) を用いて測定し、試験化合物の阻害率 (%) を以下の計算式により算出した。

$$\text{阻害率} = (E_c - E_a) / E_c \times 100$$

- 15 E_c : MCP-1 による Ca^{2+} 一過性上昇の測定値
 E_a : 試験化合物を添加した時の MCP-1 による Ca^{2+} 一過性上昇の測定値

その結果、本発明化合物は、10 μ M で 50 % 以上の阻害を示した。例えば、実施例 5 (2) 化合物は、 IC_{50} 値が 3 μ M であった。

20 [毒性]

本発明化合物の毒性は非常に低いものであり、医薬として使用するために十分安全であると判断できる。

産業上の利用可能性

25 [医薬品への適用]

ヒトを含めた動物、特にヒトにおいて、一般式（I）で示される本発明化合物は、ケモカイン／ケモカイン受容体の作用を制御するので、各種炎症性疾患、喘息、アトピー性皮膚炎、蕁麻疹、アレルギー疾患（アレルギー性気管支肺アスペルギルス症、アレルギー性好酸球性胃腸症等）、腎炎、腎症、
5 肝炎、関節炎、慢性関節リウマチ、乾癬、鼻炎、結膜炎、虚血再灌流傷害の抑制、多発性硬化症、潰瘍性大腸炎、急性呼吸窮迫症候群、細菌感染に伴うショック、糖尿病、自己免疫疾患の治療、移植臓器拒絶反応、免疫抑制、癌転移予防、後天性免疫不全症候群の予防および／または治療に有用である。

一般式（I）で示される本発明化合物、その非毒性の塩、酸付加塩、また
10 はその水和物を上記の目的で用いるには、通常、全身的または局所的に、経口または非経口の形で投与される。

投与量は、年齢、体重、症状、治療効果、投与方法、処理時間等により異なるが、通常、成人一人あたり、1回につき、1mgから1000mgの範囲で、
1日1回から数回経口投与されるか、または成人一人あたり、1回につき、
15 1mgから100mgの範囲で、1日1回から数回非経口投与（好ましくは、
静脈内投与）されるか、または1日1時間から24時間の範囲で静脈内に持続投与される。

もちろん前記したように、投与量は、種々の条件によって変動するので、
上記投与量より少ない量で十分な場合もあるし、また範囲を越えて必要な場
20 合もある。

本発明化合物を投与する際には、経口投与のための内服用固形剤、内服用液剤および、非経口投与のための注射剤、外用剤、坐剤等として用いられる。

経口投与のための内服用固形剤には、錠剤、丸剤、カプセル剤、散剤、顆粒剤等が含まれる。カプセル剤には、ハードカプセルおよびソフトカプセル
25 が含まれる。

このような内服用固形剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質は

そのままか、または賦形剤（ラクトース、マンニトール、グルコース、微結晶セルロース、デンプン等）、結合剤（ヒドロキシプロピルセルロース、ポリビニルピロリドン、メタケイ酸アルミン酸マグネシウム等）、崩壊剤（繊維素グリコール酸カルシウム等）、滑沢剤（ステアリン酸マグネシウム等）、安定剤、溶解補助剤（グルタミン酸、アスパラギン酸等）等と混合され、常法に従って製剤化して用いられる。また、必要によりコーティング剤（白糖、ゼラチン、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート等）で被覆していてもよいし、また2以上の層で被覆していてもよい。さらにゼラチンのような吸収されうる物質のカプセルも包含される。

経口投与のための内服用液剤は、薬剂的に許容される水剤、懸濁剤、乳剤、シロップ剤、エリキシル剤等を含む。このような液剤においては、ひとつまたはそれ以上の活性物質が、一般的に用いられる希釈剤（精製水、エタノールまたはそれらの混液等）に溶解、懸濁または乳化される。さらにこの液剤は、湿潤剤、懸濁化剤、乳化剤、甘味剤、風味剤、芳香剤、保存剤、緩衝剤等を含有していてもよい。

非経口投与のための注射剤としては、溶液、懸濁液、乳濁液および用時溶剤に溶解または懸濁して用いる固形の注射剤を包含する。注射剤は、ひとつまたはそれ以上の活性物質を溶剤に溶解、懸濁または乳化させて用いられる。溶剤として、例えば注射用蒸留水、生理食塩水、植物油、プロピレングリコール、ポリエチレングリコール、エタノールのようなアルコール類等およびそれらの組み合わせが用いられる。さらにこの注射剤は、安定剤、溶解補助剤（グルタミン酸、アスパラギン酸、ポリソルベート80（登録商標）等）、懸濁化剤、乳化剤、無痛化剤、緩衝剤、保存剤等を含んでいてもよい。これらは最終工程において滅菌するか無菌操作法によって製造、調製される。また無菌の固形剤、例えば凍結乾燥品を製造し、その使用前に無菌化または無

菌の注射用蒸留水または他の溶剤に溶解して使用することもできる。

非経口投与のためのその他の製剤としては、ひとつまたはそれ以上の活性物質を含み、常法により処方される外用液剤、軟膏剤、塗布剤、吸入剤、スプレー剤、坐剤および腔内投与のためのペッサリー等が含まれる。

- 5 スプレー剤は、一般的に用いられる希釈剤以外に亜硫酸水素ナトリウムのような安定剤と等張性を与えるような緩衝剤、例えば塩化ナトリウム、クエン酸ナトリウムあるいはクエン酸のような等張剤を含有していてもよい。スプレー剤の製造方法は、例えば米国特許第 2,868,691 号および同第 3,095,355 号に詳しく記載されている。

10

発明を実施するための最良の形態

以下、参考例および実施例によって本発明を詳述するが、本発明はこれらに限定されるものではない。

- 15 クロマトグラフィーによる分離の箇所および T L C に示されているカッコ内の溶媒は、使用した溶出溶媒または展開溶媒を示し、割合は体積比を表わす。

NMR の箇所に示されているカッコ内の溶媒は、測定に使用した溶媒を示している。

R * と S * は、絶対位置を表わさず相対位置のみを表わす。

20

参考例 1 : 樹脂 (2) の合成



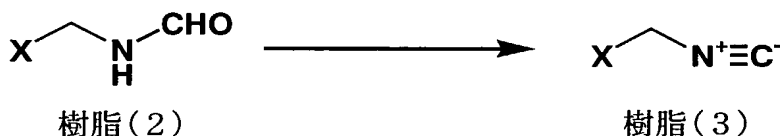
アミノメチルポリスチレン樹脂・塩酸塩 (樹脂 (1) ; X はポリスチレン樹脂を表わす。) (30.0 g) (1 % ジビニルベンゼン共重合体、渡辺化学社製、

- カタログ番号 A00062) をジメチルホルムアミド (300 ml)、10% ジイソプロピルエチルアミン-ジメチルホルムアミド溶液 (300 ml) およびジメチルホルムアミド (300 ml) で順次洗浄し、ジメチルホルムアミド (200 ml) に懸濁した。懸濁液に、ギ酸 (10.2 ml) およびジイソプロピルカルボジイミド (42.3 ml) を、氷冷下に加え、室温で1時間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、ジメチルホルムアミド (250 ml × 3回)、ジクロロメタン (250 ml × 4回)、メタノール (250 ml × 2回) およびジクロロメタン (250 ml × 4回) で洗浄して、樹脂 (2) を得た。

I R (KBr) : ν 1682 cm^{-1} 。

10

参考例 2 : 樹脂 (3) の合成

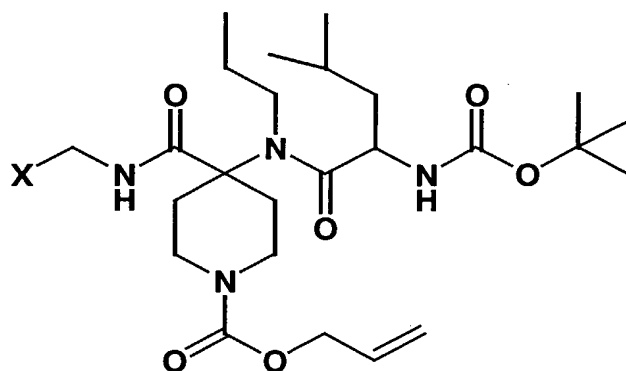


- 参考例 1 で得た樹脂 (2) のジクロロメタン (300 ml) 懸濁液に、トリエチルアミン (18.8 ml)、四塩化炭素 (13.0 ml) およびトリフェニルホスフィン (35.4 g) を加え、1時間加熱還流した。反応溶液を室温で冷却後、樹脂をろ取した。樹脂を、ジクロロメタン (250 ml × 3回)、メタノール (250 ml × 1回) およびジクロロメタン (250 ml × 2回) で洗浄し、減圧乾燥して、樹脂 (3) (28.2 g) を得た。

I R (KBr) : ν 2147 cm^{-1} 。

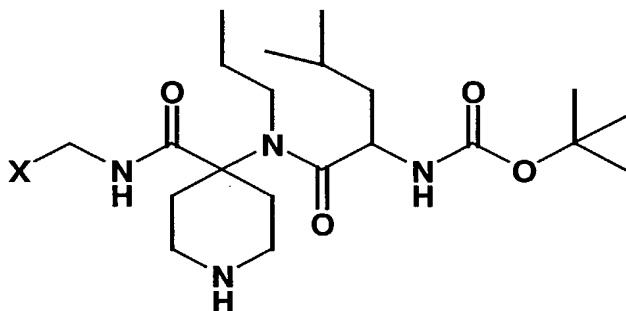
20

参考例 3 : 化合物 (1) の合成



参考例 2 で製造した樹脂 (3) (2.5 g) のテトラヒドロフラン／メタノール (1 : 1 ; 25 ml) の懸濁液に、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン (2.15 g)、n-プロピルアミン (0.97 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシン (2.93 g) を加え、65℃で16時間攪拌した。反応溶液を室温で冷却し、樹脂をろ取した。得られた樹脂をテトラヒドロフラン (25 ml × 2回)、メタノール (25 ml × 2回) およびジクロロメタン (25 ml × 2回) で洗浄して、化合物 (1) を得た。

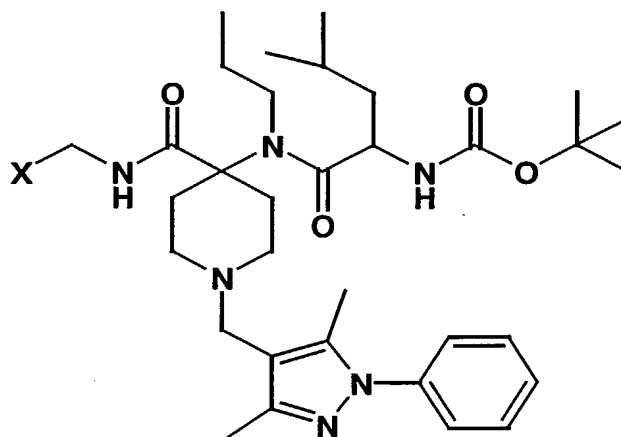
10 参考例 4 : 化合物 (2) の合成



参考例 3 で製造した化合物 (1) のジクロロメタン (25 ml) 懸濁液に、酢酸 (0.81 ml)、水素化トリブチルスズ (1.90 ml) およびテトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) 錯体 (270 mg) を加え、室温で6時間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、ジクロロメタン (25 ml × 3回)、メタノール (25 ml × 2回)、ジクロロメタン (25 ml × 2回)

およびジメチルホルムアミド（25 ml × 3回）で洗浄して、化合物（2）を得た。

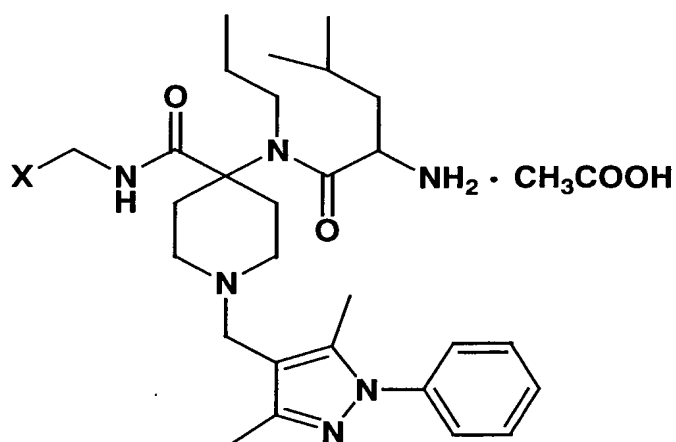
参考例 5：化合物（3）の合成



5

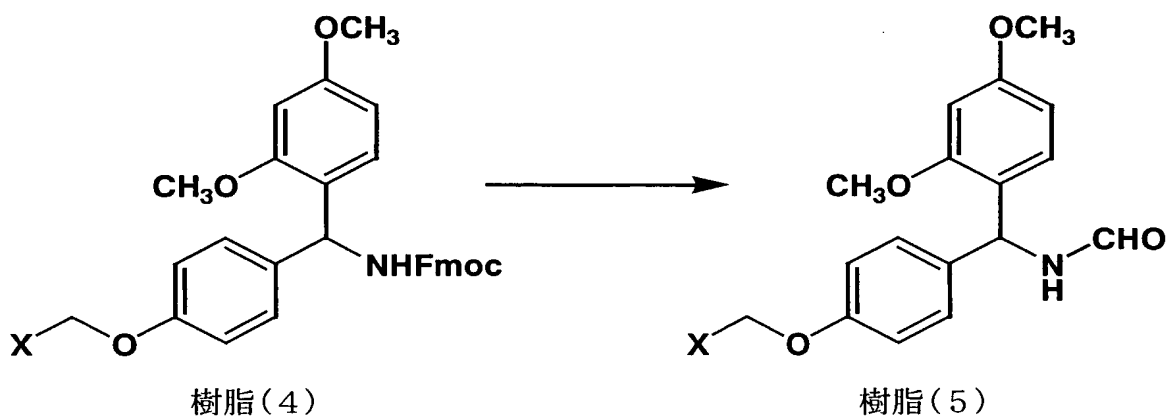
参考例 4 で製造した化合物（2）のジメチルホルムアミド（25 ml）懸濁液に、3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-ホルミルピラゾール（1.41 g）、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム（1.50 g）および酢酸（0.2 ml）を加え、室温で16時間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、ジメチルホルムアミド（20 ml × 2回）、ジクロロメタン（20 ml × 2回）、メタノール（20 ml × 2回）およびジクロロメタン（20 ml × 4回）で洗浄して、化合物（3）を得た。

参考例 6：化合物（4）の合成



参考例 5 で製造した化合物 (3) を、50%トリフルオロ酢酸-ジクロロメタン (25 ml) 溶液に懸濁し、室温で 5 分間攪拌した。反応溶液をろ過し、得られた樹脂を再度 50%トリフルオロ酢酸-ジクロロメタン溶液 (25 ml) に懸濁し、室温で 30 分間攪拌した。反応溶液からろ取した樹脂を、ジクロロメタン (25 ml × 4 回)、トルエン (25 ml × 4 回)、1.25M 酢酸-トルエン溶液 (25 ml × 1 回) で洗浄して、化合物 (4) を得た。

参考例 7 : 樹脂 (5) の合成



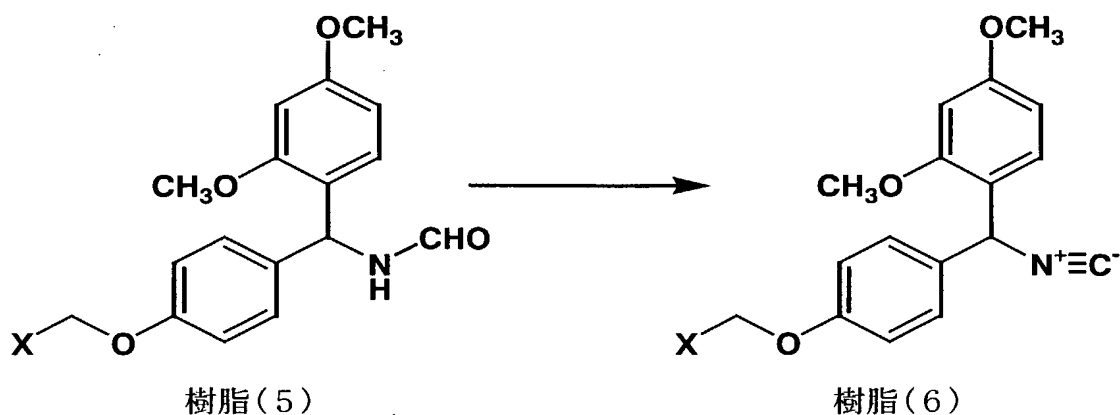
10

9-フルオレニルメチルオキシカルボニルアミノ-Rink 樹脂 (樹脂 (4)) (5.0 g) (1%ジビニルベンゼン共重合体、渡辺化学社製、カタログ番号 A00102) をジメチルホルムアミド (50 ml × 3 回)、20%ピペリ

ジメチルホルムアミド溶液（50 ml × 2回）で洗浄した。洗浄した樹脂を20%ピペリジンジメチルホルムアミド溶液（50 ml）に懸濁し、室温で30分間攪拌した。反応溶液をろ過し、得られた樹脂をジメチルホルムアミド（50 ml × 5回）で洗浄した。洗浄した樹脂のジメチルホルムアミド（20 ml）懸濁液に、ギ酸エチル（30 ml）を加え、6時間加熱還流した。室温で冷却後、反応溶液をろ過した。ろ取した樹脂をジメチルホルムアミド（50 ml × 2回）、ジクロロメタン（50 ml × 4回）、メタノール（50 ml × 4回）およびジクロロメタン（50 ml × 4回）で洗浄し、減圧乾燥して樹脂（5）（4.34 g）を得た。

10 IR (KBr) : ν 1693 cm^{-1} 。

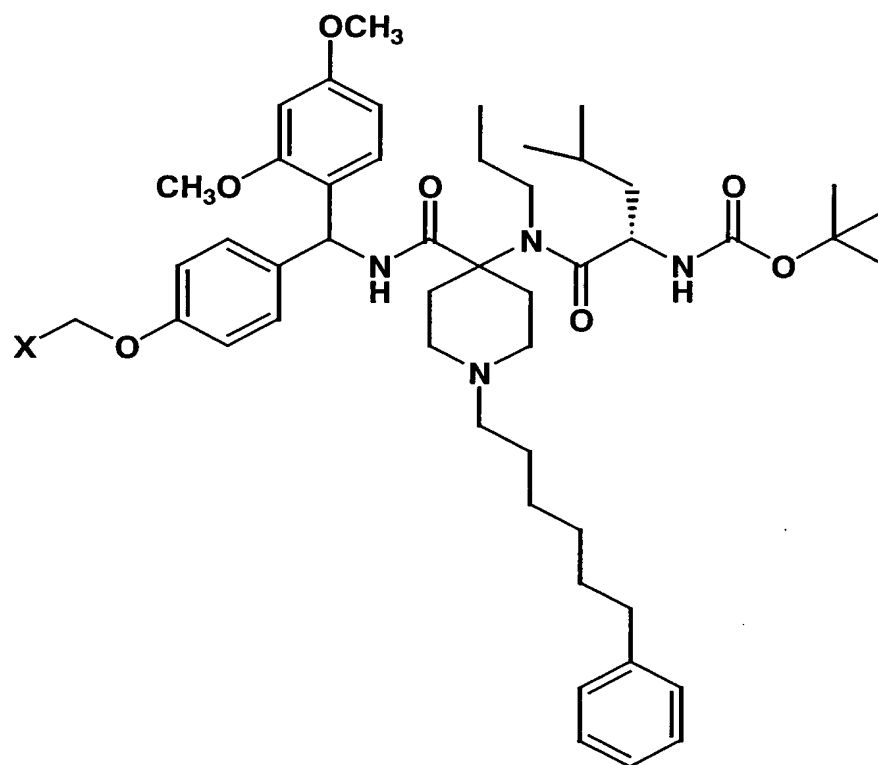
参考例8：樹脂（6）の合成



参考例7で製造した樹脂（4）（4.0 g）を用いて、参考例2と同様の操作をし、樹脂（6）（3.56 g）を得た。

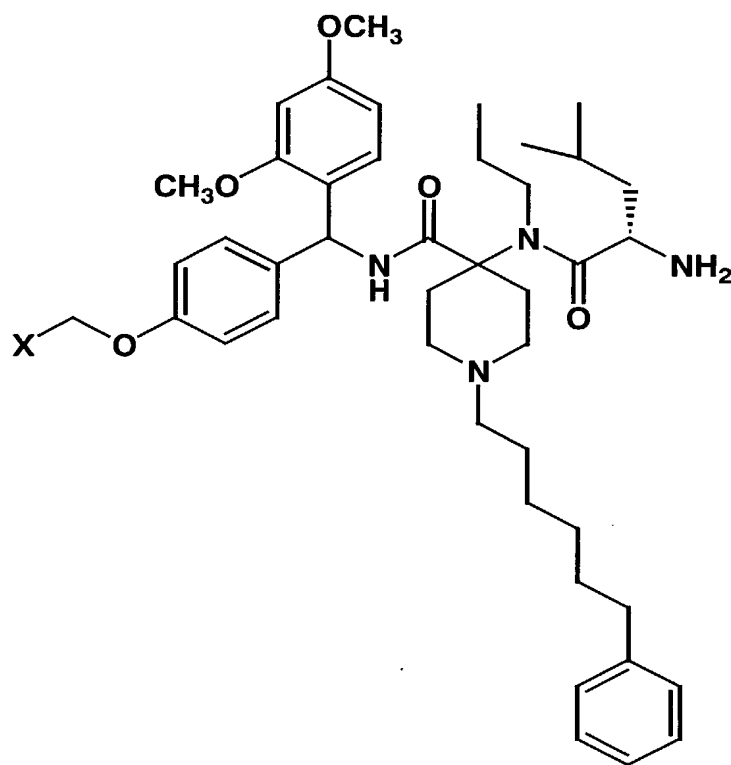
IR (KBr) : ν 2136 cm^{-1} 。

参考例9：化合物（5）の合成



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (1.0 g)、N-(6-フェニルヘキシル)-4-ピペリドン (0.44 g)、n-プロピルアミン (0.14 ml)、および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシン (0.42 g) を用いて、参考例 5 3 と同様の操作をし、化合物 (5) を得た。

参考例 10 : 化合物 (6) の合成

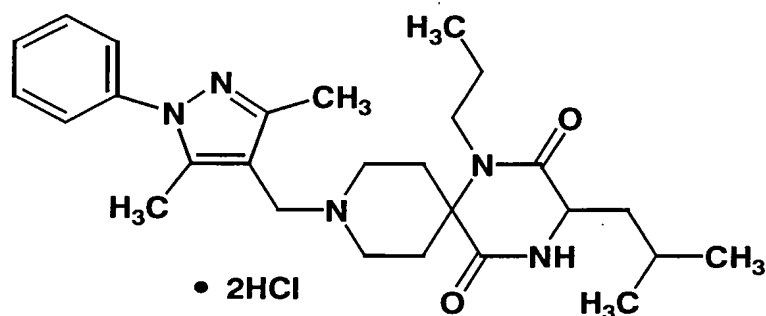


参考例 9 で製造した化合物 (5) の 1.5M 2, 6-エチルピリジンジクロロメタン (4 ml) 懸濁液に、1 M トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリルジクロロメタン溶液 (4 ml) を加え、室温で 30 分間攪拌した。反応
 5 溶液をろ過し、得られた樹脂を再度、1.5M 2, 6-エチルピリジンジクロロメタン溶液 (4 ml) に懸濁し、1 M トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリルジクロロメタン溶液 (4 ml) を加え、室温で 30 分間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、ジクロロメタン (6 ml × 4 回)、メタノール (6 ml × 4 回)、およびトルエン (6 ml × 5 回) で洗浄し、化合物 (6)
 10 を得た。

実施例 1

9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1-プロピル-1, 4,

9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・二塩酸塩



参考例6で製造した化合物(4)を1.25M酢酸-トルエン溶液(25ml)に懸濁し、90℃で24時間、続いて室温で16時間攪拌した。反応溶液をろ過し、得られた樹脂をクロロホルム-メタノール(1:1; 20ml×2回)で洗浄した。ろ液と洗浄液を濃縮した。残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー(富士シリシア化学社製、FL60D; クロロホルム:メタノール=30:1)で精製した。得られた残渣のメタノール溶液を、1N塩酸で酸性にした後、濃縮して、以下の物性値を有する標題化合物(703mg)を得た。

TLC: R_f 0.50 (クロロホルム:メタノール=10:1);
 NMR (CD₃OD): δ 7.68-7.50 (m, 5H), 4.36 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 5.2 Hz, 1H), 3.83 (m, 2H), 3.64 (m, 2H), 3.47 (m, 2H), 2.64 (m, 2H), 2.49 (s, 3H), 2.44 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.81 (m, 1H), 1.68 (m, 2H), 1.60 (m, 2H), 1.05-0.90 (m, 9H);

IR (KBr): ν 3424, 3215, 2960, 2873, 2492, 1671, 1645, 1554, 1501, 1468, 1418, 1370, 1330, 1297, 1243, 1148, 958, 928, 754, 698 cm⁻¹;

MS (MALDI, Pos., α-CHCA): 488 (M + Na)⁺, 466 (M + H)⁺, 185.

元素分析: 計算値 (C₂₇H₃₉N₅O₂ · 2HCl) C: 60.22%, H: 7.67%, N: 13.00%。

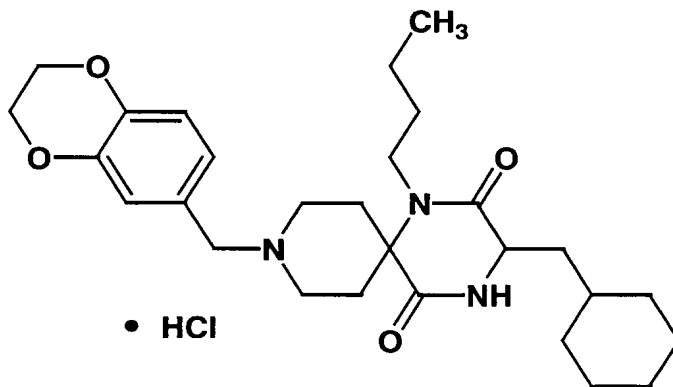
実測値 C: 59.89%, H: 7.67%, N: 12.79%。

実施例 2 (1) ~ 2 (3)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アリルオキシカルボニル-4-
 ピペリドンを用いて、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカ
 5 ルボニル)ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3 →
 参考例 4 と同様の操作をし、さらに、3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-
 -ホルミルピラゾールの代わりに相当する化合物を用いて、参考例 5 → 参考
 例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

10 実施例 2 (1)

9- (1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1-ブチル-3-シ
 クロヘキシルメチル-2, 5-ジオキソ-1, 4, 9-トリアザスピロ [5.
 5] ウンデカン・塩酸塩



15 T L C : R f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.08 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 6.99 (dd, J = 8.0, 2.2 Hz, 1H), 6.92
 (d, J = 8.0 Hz, 1H), 4.27 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 3.74
 (m, 2H), 3.60 - 3.35 (m, 4H), 2.43 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.90 - 1.60 (m, 7H),
 1.60 - 1.45 (m, 2H), 1.45 - 1.30 (m, 2H), 1.30 - 1.10 (m, 4H), 1.10 - 0.80 (m,
 20 5H) ;

I R (KBr) : ν 3436, 2926, 2852, 2511, 1675, 1645, 1591, 1511, 1418, 1374, 1294, 1261, 1068, 1050, 930, 888 cm^{-1} ;

M S (MALDI, Pos., α -CHCA) : 484 (M + H)⁺, 149.

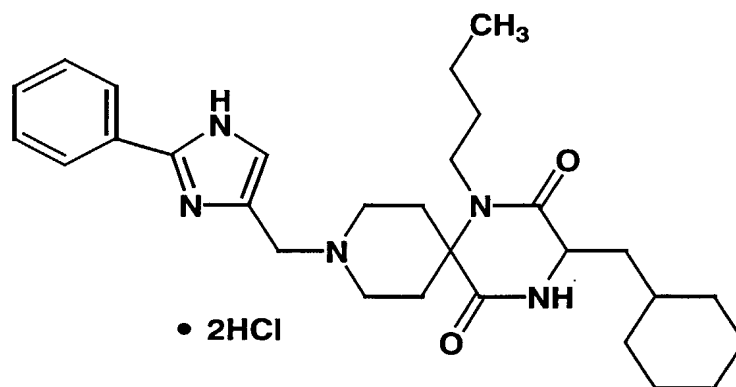
元素分析 : 計算値 (C₂₈H₄₁N₃O₄ · HCl) C : 64.66%, H : 8.14%, N :

5 8.08%.

実測値 C : 64.00%, H : 7.94%, N : 7.90%.

実施例 2 (2)

10 1-ブチル-3-シクロヘキシルメチル-2,5-ジオキソ-9-(2-フェニルイミダゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・二塩酸塩



T L C : R f 0.25 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 8.05 - 7.94 (m, 3H), 7.75 - 7.60 (m, 3H), 4.59 (s, 2H), 4.05 (dd, J = 7.4, 4.8 Hz, 1H), 3.88 (m, 2H), 3.65 (m, 2H), 3.51 (m, 2H), 2.68 (m, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.90 - 1.60 (m, 6H), 1.60 - 1.45 (m, 3H), 1.45 - 1.30 (m, 3H), 1.30 - 1.10 (m, 3H), 1.10 - 0.80 (m, 5H) ;

I R (KBr) : ν 3423, 2927, 2854, 2664, 1672, 1644, 1421, 1373, 1177, 775, 709, 688 cm^{-1} ;

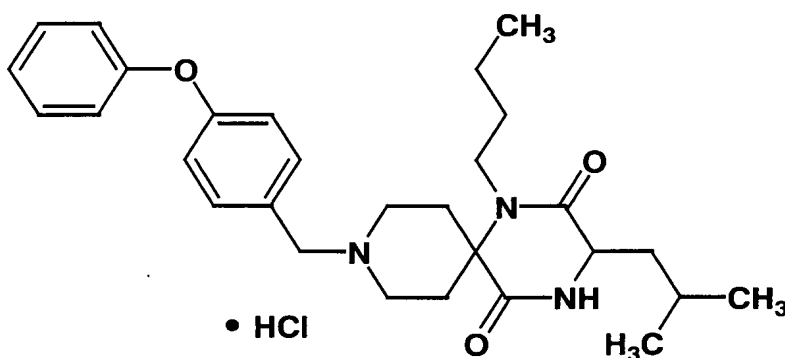
20 M S (MALDI, Pos., α -CHCA) : 492 (M + H)⁺.

元素分析：計算値 ($C_{29}H_{41}N_5O_2 \cdot 2HCl \cdot 2.8H_2O$) C : 56.63%、H : 7.96%、N : 11.39%。

実測値 C : 56.90%、H : 7.23%、N : 10.78%。

5 実施例 2 (3)

1-ブチル-3-(2-メチル-1-プロピル)-2,5-ジオキソ-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

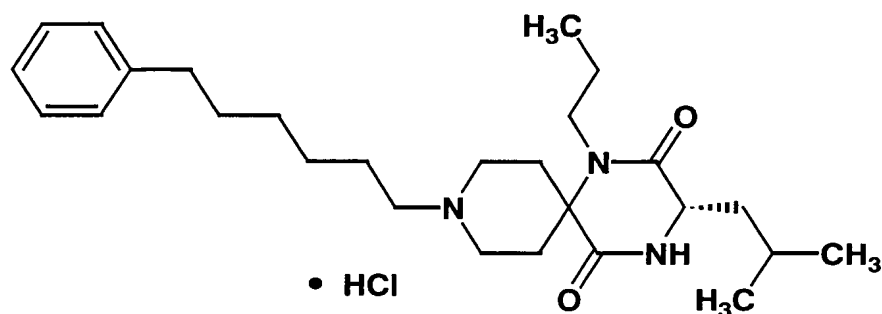


- 10 TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.54 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.18 (m, 1H), 7.11 - 7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.60 - 3.35 (m, 4H), 2.46 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.80 (m, 1H), 1.70 (m, 1H), 1.54 (m, 2H), 1.37 (m, 3H), 1.00 - 0.90 (m, 9H) ;
- 15 IR (KBr) : ν 3440, 3221, 3066, 2957, 2871, 2559, 1673, 1590, 1509, 1489, 1419, 1371, 1329, 1242, 1172, 873, 693 cm⁻¹ ;
 MS (MALDI, Pos., α -CHCA) : 478 (M + H)⁺, 183.
 元素分析：計算値 ($C_{29}H_{39}N_3O_3 \cdot HCl$) C : 67.75%、H : 7.84%、N : 8.17%。
 20 実測値 C : 67.29%、H : 7.70%、N : 8.06%。

実施例 2 (4)

(3S)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1-プロピル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]

5 ウンデカン・塩酸塩



参考例 10 で製造した化合物 (6) を用いて、実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する標題化合物 (69 mg) を得た。

TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.18 (m, 5H), 4.02 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 3.70 (m, 2H), 3.56 (m, 2H), 3.39 (m, 2H), 3.11 (m, 2H), 2.63 (dd, J = 7.8, 7.2 Hz, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.95 - 1.50 (m, 9H), 1.42 (m, 4H), 1.00 - 0.89 (m, 9H) ;

IR (KBr) : ν 3435, 3205, 3082, 3026, 2935, 2870, 2493, 2361, 1674, 1454, 1417, 1370, 1331, 1155, 1071, 1004, 961, 750, 700 cm⁻¹ ;

15 MS (FAB, Pos., グリセリン-m-ニトロベンジルアルコール) : 442 (M + H)⁺, 232, 171, 79 (base peak)。

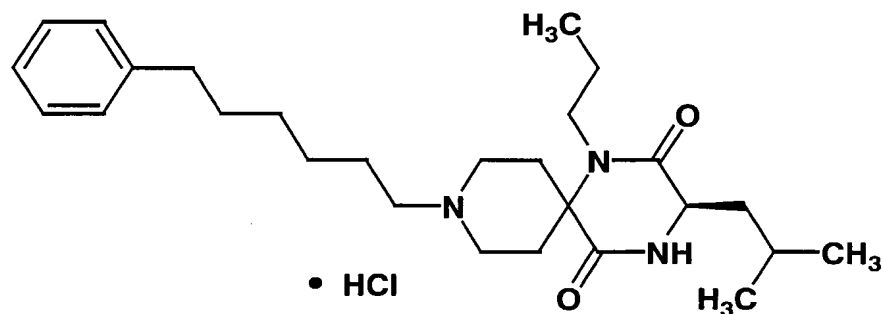
元素分析 : 計算値 (C₂₇H₄₃N₃O₂ · HCl) C : 67.83%、H : 9.28%、N : 8.79%。

実測値 C : 67.56%、H : 9.50%、N : 8.71%。

20

実施例 2 (5)

(3R)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1-プロピル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



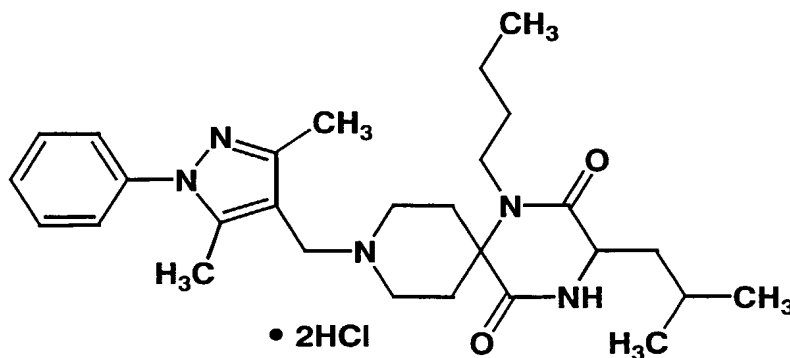
- 5 参考例 8 で製造した樹脂 (6) (1.0 g)、N-(6-フェニルヘキシル)-4-ピペリドン (0.44 g)、n-プロピルアミン (0.14 ml) および N-(tert-ブチルオキシカルボニル)-D-ロイシン (0.42 g) を用いて、参考例 9 → 参考例 10 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する標題化合物 (63 mg) を得た。
- 10 TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.18 (m, 5H), 4.02 (dd, J = 7.6, 4.6 Hz, 1H), 3.70 (m, 2H), 3.56 (m, 2H), 3.39 (m, 2H), 3.11 (m, 2H), 2.63 (dd, J = 7.8, 7.2 Hz, 2H), 2.48 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.95 - 1.50 (m, 9H), 1.42 (m, 4H), 1.00 - 0.89 (m, 9H) ;
 IR (KBr) : ν 3441, 3204, 3082, 3026, 2935, 2870, 2660, 2499, 2413, 2361, 1674,
 15 1455, 1417, 1370, 1330, 1267, 1205, 1154, 1070, 1003, 960, 928, 899, 750, 700 cm⁻¹ ;
 MS (FAB, Pos., グリセリン-m-ニトロベンジルアルコール) : 442 (M + H)⁺ (base peak), 294, 232, 202, 171, 79。
 元素分析 : 計算値 (C₂₇H₄₃N₃O₂ · HCl) C : 67.83%, H : 9.28%, N :
 20 8.79%。
 実測値 C : 67.52%, H : 9.51%, N : 8.70%。

実施例 3 (1) ~ 3 (4)

参考例 2 で製造した樹脂 (3) および N-アシルオキシカルボニル-4-
 ピペリドンを用いて、n-プロピルアミンおよび N-(t-ブチルオキシカ
 5 ルボニル)ロイシンの代わりにそれぞれ相当する化合物を用いて、参考例 3 →
 参考例 4 と同様の操作をし、さらに 3, 5-ジメチル-1-フェニル-4-
 ホルミルピラゾールの代わりに、相当する化合物を用いて、参考例 5 → 参考
 例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

10 実施例 3 (1)

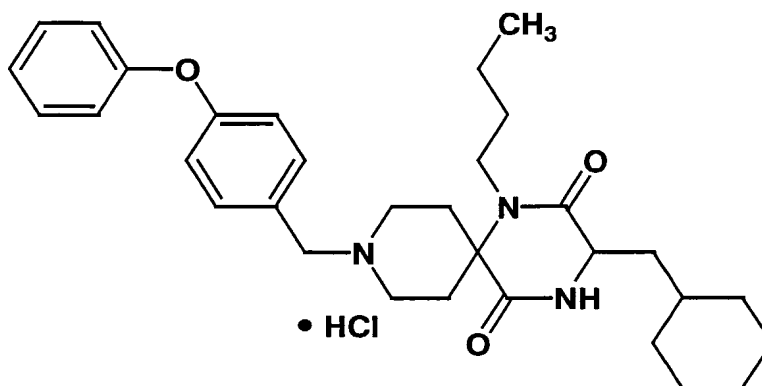
1-ブチル-9-((3, 5-ジメチル-1-フェニル)-4-ピラゾリル)
 メチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1, 4,
 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・二塩酸塩



- 15 TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.70 - 7.48 (m, 5H), 4.35 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz,
 1H), 3.83 (m, 2H), 3.63 (m, 2H), 3.51 (m, 2H), 2.64 (m, 2H), 2.48 (s, 3H), 2.43
 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.81 (m, 2H), 1.71 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.50 - 1.35 (m,
 4H), 1.05 - 0.90 (m, 6H)。

実施例 3 (2)

1-ブチル-3-シクロヘキシルメチル-2,5-ジオキソ-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



5

TLC: R_f 0.73 (クロロホルム:メタノール=10:1);

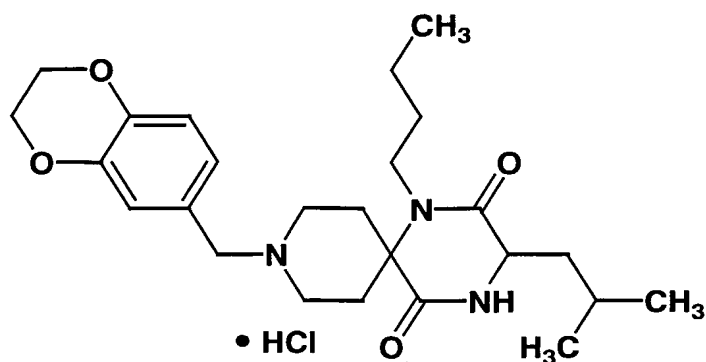
NMR (CD₃OD): δ 7.74 - 7.56 (m, 1H), 7.53 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.18 (m, 1H), 7.10 - 7.00 (m, 3H), 4.33 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.4, 4.8 Hz, 1H), 3.80 (m, 2H), 3.60 - 3.35 (m, 4H), 2.43 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.90 - 1.60 (m, 7H), 1.60 - 1.45 (m, 2H), 1.45 - 1.30 (m, 2H), 1.30 - 1.15 (m, 4H), 1.10 - 0.80 (m, 5H).

10

実施例 3 (3)

9-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1-ブチル-3-(2-メチル-1-プロピル)-2,5-ジオキソ-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15

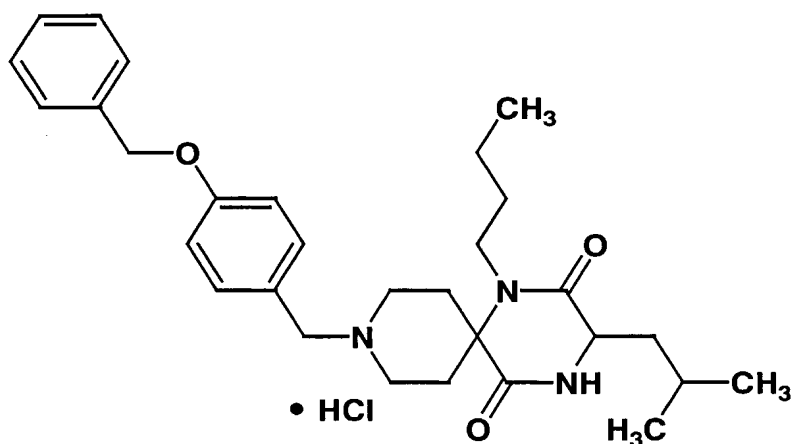


TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.08 (d, J = 2.2 Hz, 1H), 7.01 (dd, J = 8.2, 2.2 Hz, 1H), 6.93 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.27 (s, 4H), 4.23 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.55 - 3.35 (m, 4H), 2.43 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.80 (m, 1H), 1.67 (m, 2H), 1.55 (m, 2H), 1.37 (m, 2H), 1.00 - 0.90 (m, 9H)。

実施例 3 (4)

9 - (4 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 1 - プチル - 2, 5 - ジオキ
 10 ソ - 3 - (2 - メチル - 1 - プロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.
 5] ウンデカン・塩酸塩



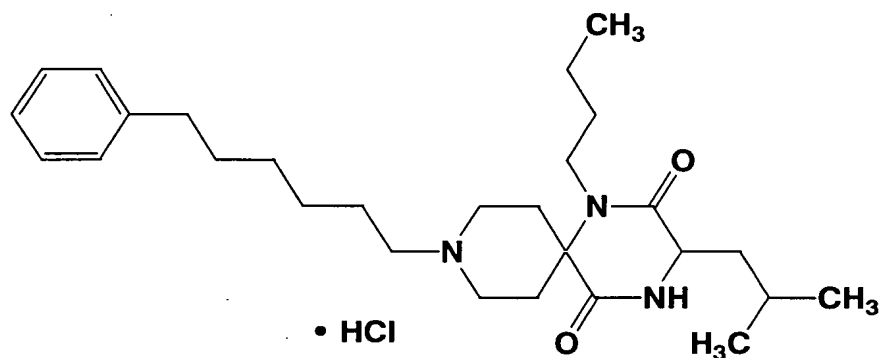
TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.54 - 7.25 (m, 7H), 7.10 (m, 2H), 5.13 (s, 2H), 4.27 (s,

2H), 4.00 (dd, $J = 8.2, 4.8$ Hz, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.55 - 3.35 (m, 4H), 2.42 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.90 - 1.25 (m, 7H), 1.00 - 0.90 (m, 9H)。

実施例 4

- 5 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩



- 参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-(6-フェニルヘキシル)-4-ピ
 10 ペリドン、n-ブチルアミンおよびN-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイ
 シンを用いて、参考例 3 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の物
 性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- NMR (CD₃OD) : δ 7.30 - 7.06 (m, 5H), 4.02 (dd, $J = 7.8, 4.8$ Hz, 1H), 3.70 (m,
 15 2H), 3.56 (m, 2H), 3.43 (m, 2H), 3.11 (m, 2H), 2.63 (t, $J = 7.8$ Hz, 2H), 2.46 (m,
 2H), 2.18 (m, 2H), 1.95 - 1.50 (m, 9H), 1.50 - 1.25 (m, 6H), 0.97 (m, 9H)。

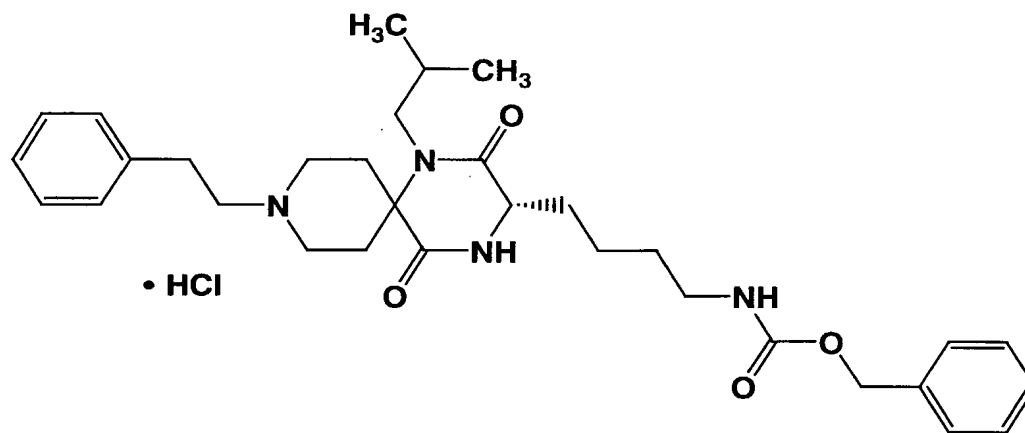
実施例 5 (1) ~ 5 (12)

- N-(6-フェニルヘキシル)-4-ピペリドン、n-プロピルアミンおよ
 20 びN-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-ロイシンの代わりにそれぞれ相
 当する化合物と参考例 8 で製造した樹脂 (6) を用いて、参考例 9 → 参考例

10 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

実施例 5 (1)

(3S)-1-(2-メチルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

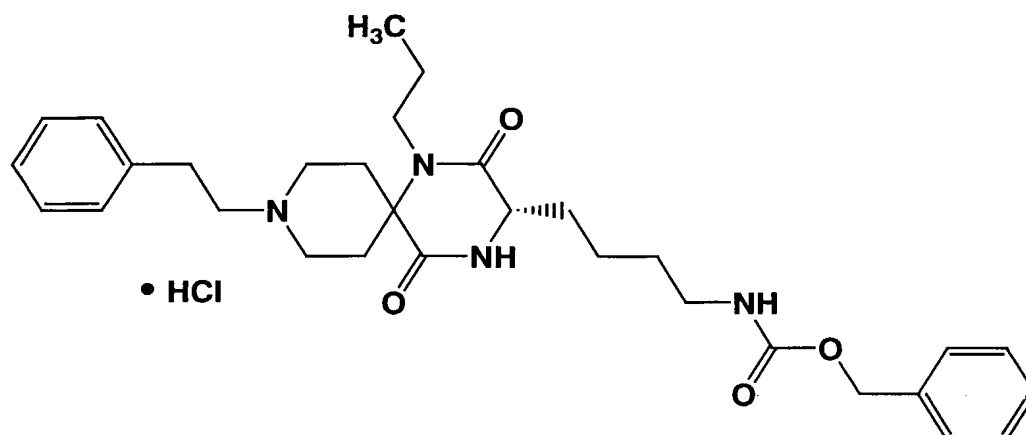


TLC : R_f 0.52 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 10H), 5.07 (s, 2H), 4.12 (m, 1H), 3.94 (m, 1H),
 10 3.61 (m, 5H), 3.39 (m, 2H), 3.13 (m, 4H), 2.31 (m, 4H), 1.92 (m, 3H), 1.51 (m,
 2H), 1.39 (m, 2H), 0.93 (t, J = 6.4 Hz, 6H)。

実施例 5 (2)

(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

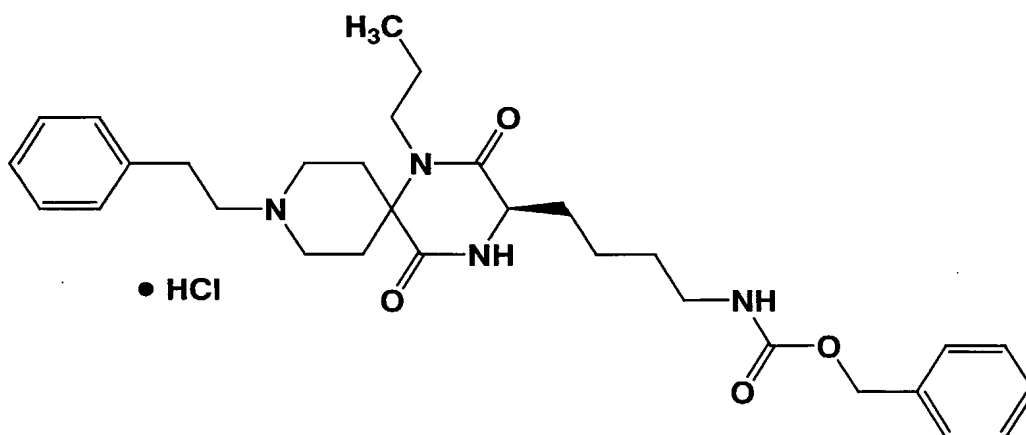


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 10H), 5.06 (m, 2H), 4.07 (m, 1H), 3.86 (m, 1H), 3.76 (m, 1H), 3.63 (m, 2H), 3.37 (m, 4H), 3.12 (m, 4H), 2.43 (m, 2H), 2.21 (m, 2H), 1.86 (m, 2H), 1.55 (m, 4H), 1.37 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (3)

(3R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



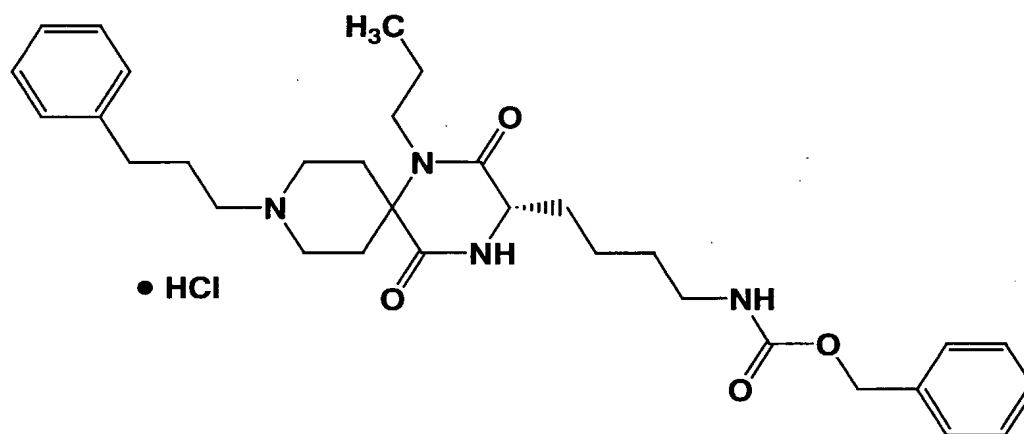
TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 10H), 5.06 (s, 2H), 4.07 (m, 1H), 3.86 (m, 1H),

3.76 (m, 1H), 3.63 (m, 2H), 3.37 (m, 4H), 3.12 (m, 4H), 2.43 (m, 2H), 2.21 (m, 2H), 1.86 (m, 2H), 1.55 (m, 4H), 1.37 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (4)

- 5 (3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

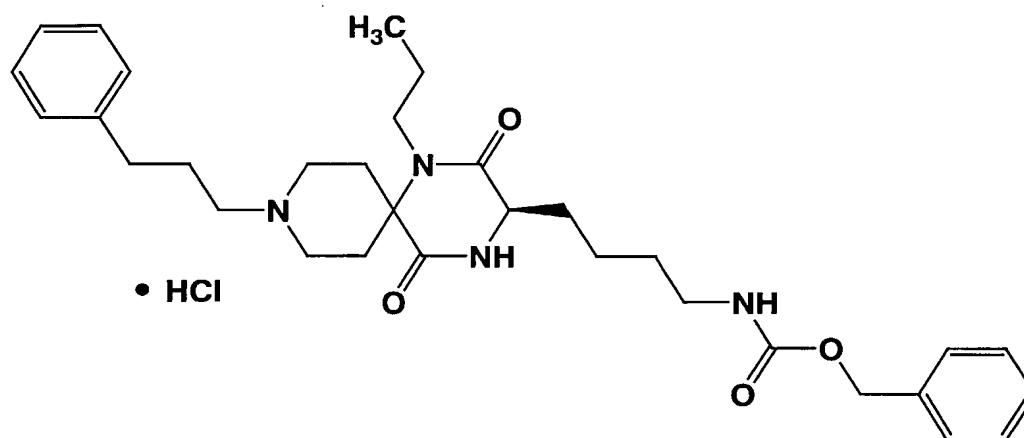


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 5H), 7.26 (m, 5H), 5.05 (s, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.85 - 3.30 (m, 6H), 3.12 (m, 4H), 2.73 (t, J = 7.6 Hz, 2H), 2.44 (m, 2H), 2.13 (m, 4H), 1.85 (m, 2H), 1.54 (m, 4H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (5)

- 15 (3R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

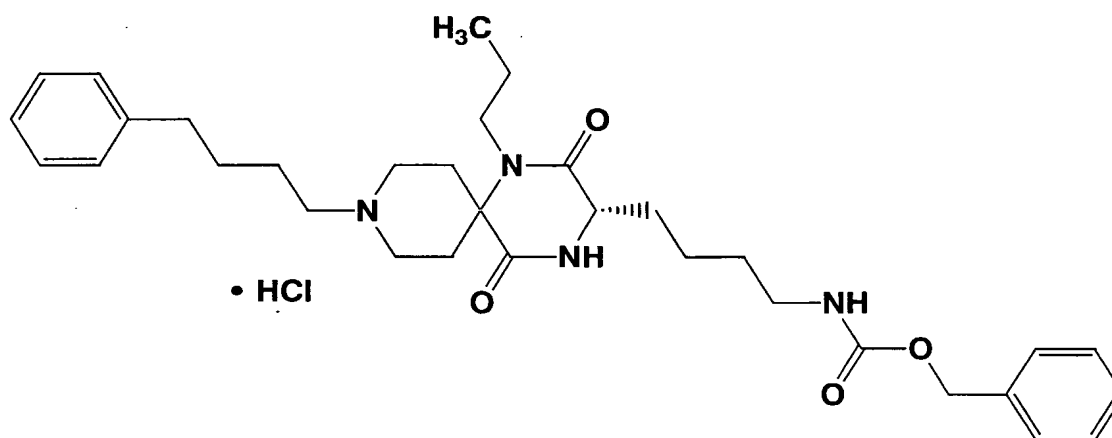


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 5H), 7.26 (m, 5H), 5.05 (s, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.85 - 3.30 (m, 6H), 3.12 (m, 4H), 2.73 (t, J = 7.2 Hz, 2H), 2.44 (m, 2H), 2.13 (m, 4H),
 5 1.85 (m, 2H), 1.54 (m, 4H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (6)

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩
 10



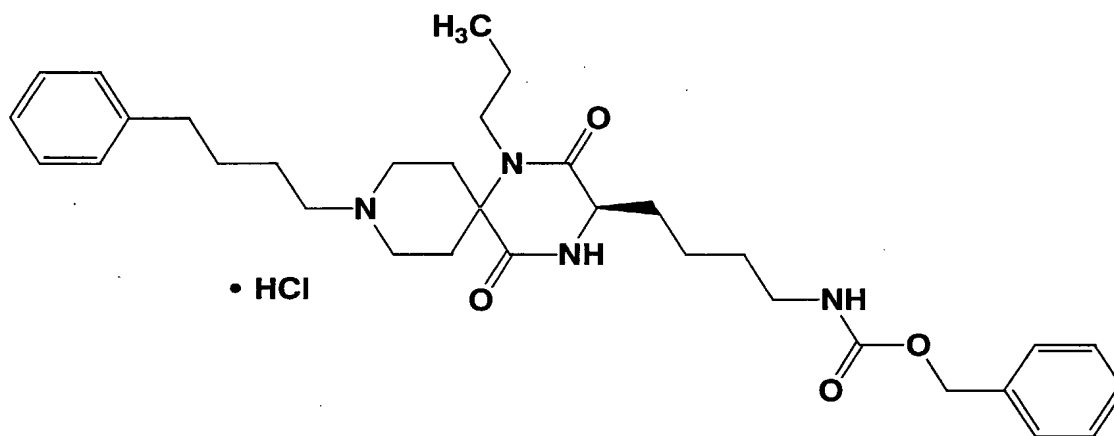
TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 5H), 7.22 (m, 5H), 5.06 (s, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.85

- 3.38 (m, 6H), 3.12 (m, 4H), 2.70 (m, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.74 (m, 6H), 1.54 (m, 4H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 5 (7)

- 5 (3R) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノプロチル) - 9 - (4 - フェニルプロチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

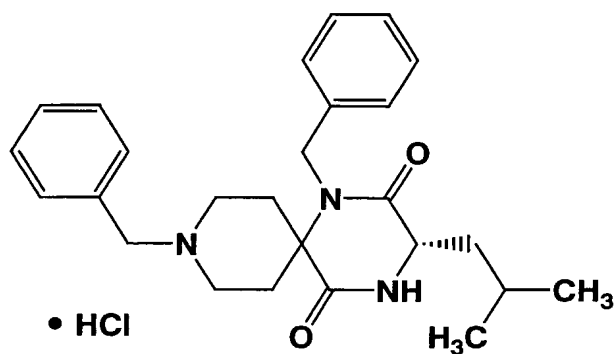


TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 5H), 7.22 (m, 5H), 5.06 (s, 2H), 4.05 (m, 1H), 3.85 - 3.38 (m, 6H), 3.12 (m, 4H), 2.70 (m, 2H), 2.40 (m, 2H), 2.18 (m, 2H), 1.74 (m, 6H), 1.54 (m, 4H), 1.38 (m, 2H), 0.94 (t, J = 7.0 Hz, 3H)。

実施例 5 (8)

- 15 (3S) - 1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

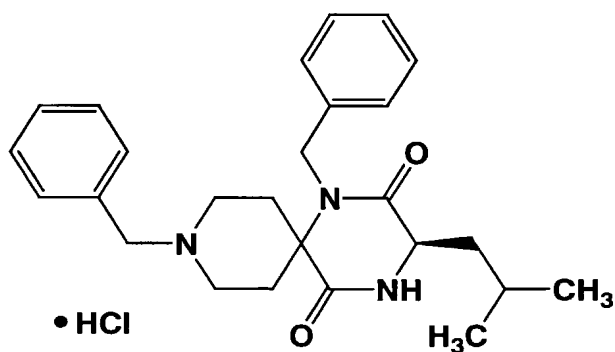


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (m, 5H), 7.23 (m, 5H), 4.82 (m, 2H), 4.31 (s, 2H),
 4.17 (dd, J = 8.0, 4.6 Hz, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.08 (m,
 5 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.0 Hz, 6H)。

実施例 5 (9)

(3R)-1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-
 -9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸
 10 塩

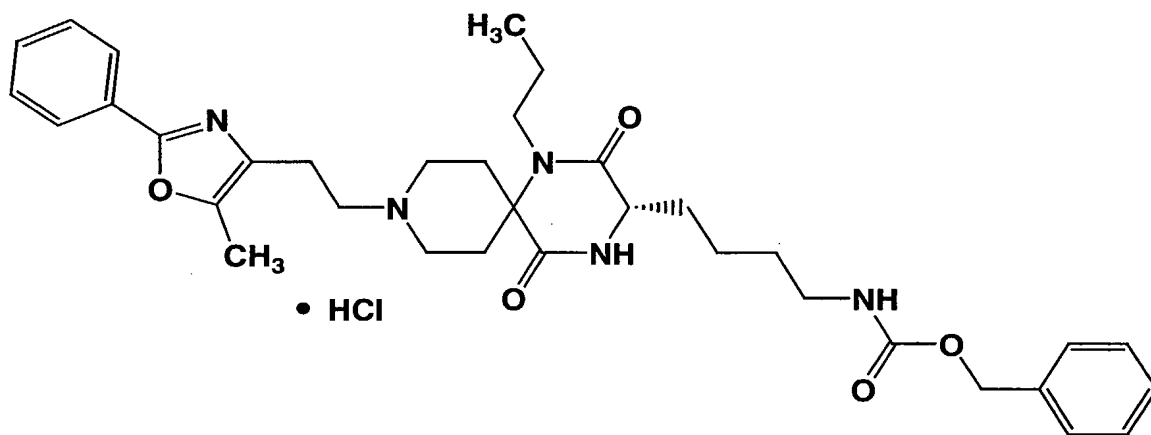


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (m, 5H), 7.23 (m, 5H), 4.82 (m, 2H), 4.31 (s, 2H),
 4.17 (dd, J = 8.0, 4.6 Hz, 1H), 3.72 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.52 (m, 2H), 2.08 (m,
 15 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.0 Hz, 6H)。

実施例 5 (10)

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - (2 - フェニル - 5 - メチル
5 オキサゾール - 4 - イル) エチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

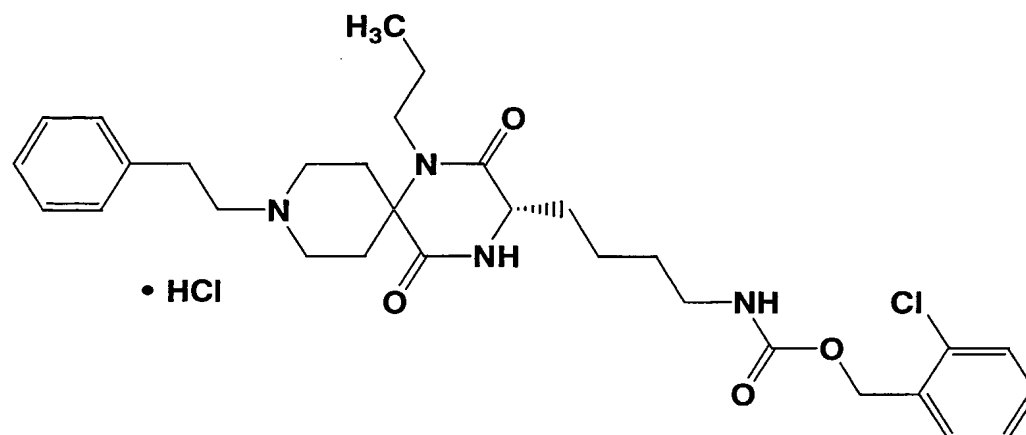


TLC : R_f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (m, 2H), 7.53 (m, 3H), 7.34 (m, 5H), 5.07 (s, 2H),
10 4.08 (dd, J = 5.4, 4.4 Hz, 1H), 4.00 - 3.60 (m, 4H), 3.47 (m, 4H), 3.13 (m, 4H),
2.56 (m, 2H), 2.46 (s, 3H), 2.25 (m, 2H), 1.87 (m, 2H), 1.75 - 1.25 (m, 6H), 0.94
(t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (11)

15 (3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - (2 - クロロフェニルメチル) オキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

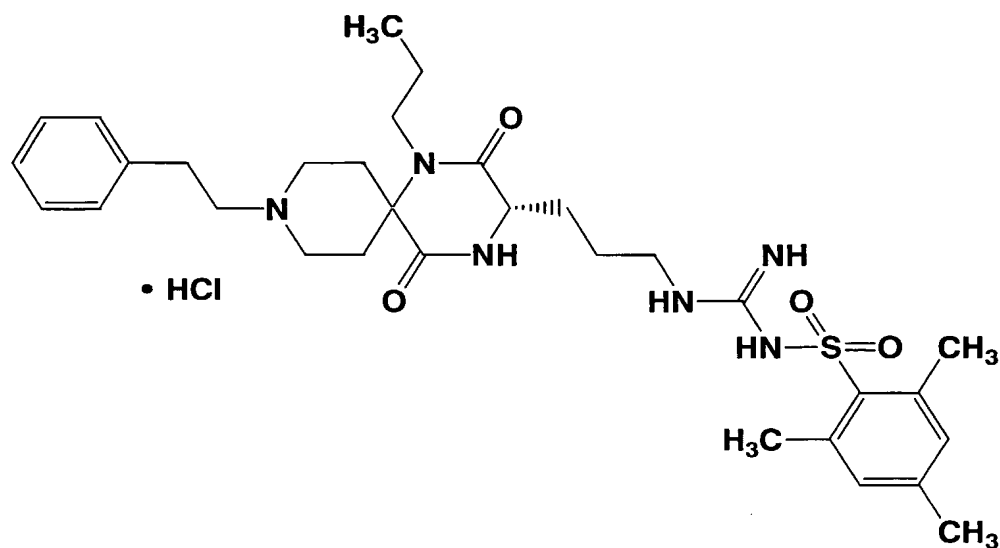


TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.33 (m, 9H), 5.17 (s, 2H), 4.08 (dd, J = 5.2, 4.8 Hz, 1H),
 3.80 (m, 2H), 3.65 (m, 3H), 3.39 (m, 3H), 3.14 (m, 4H), 2.50 (m, 2H), 2.22 (m,
 5 2H), 1.85 (m, 2H), 1.70 - 1.20 (m, 6H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 5 (12)

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - [3 - (3 - (2, 4,
 6 - トリメチルフェニルスルホニル) グアニジノ) プロピル] - 9 - (2 -
 10 フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩
 酸塩



TLC : R_f 0.39 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.32 (m, 5H), 7.05 (s, 2H), 4.10 (m, 1H), 3.88 (m, 1H), 3.67 (m, 3H), 3.40 (m, 4H), 3.18 (m, 4H), 2.66 (s, 6H), 2.51 (m, 2H), 2.31 (s, 3H), 2.21 (m, 2H), 1.82 (m, 2H), 1.60 (m, 4H), 0.96 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 6 (1) ~ 6 (32)

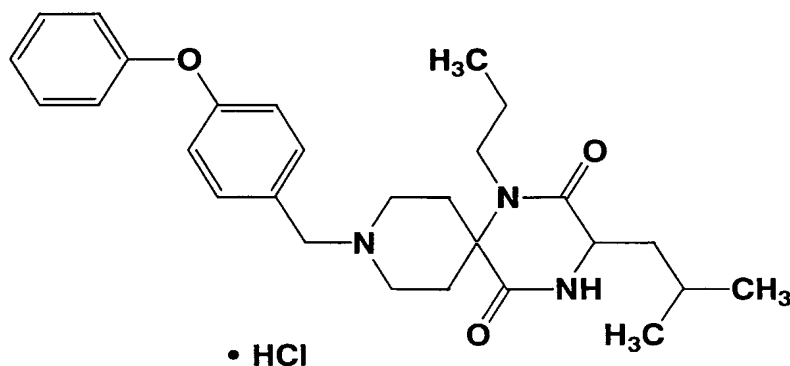
参考例 2 で製造した樹脂 (3)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン、相当するアミン誘導体および相当するアミノ酸誘導体を用いて、参考例 3 → 参考例 4 と同様の操作をし、さらに相当するアルデヒド誘導体を用いて、参考例 5 → 参考例 6 → 実施例 1 と同様の操作をし、以下の本発明化合物を得た。

10

実施例 6 (1)

1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

15



TLC : R_f 0.61 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

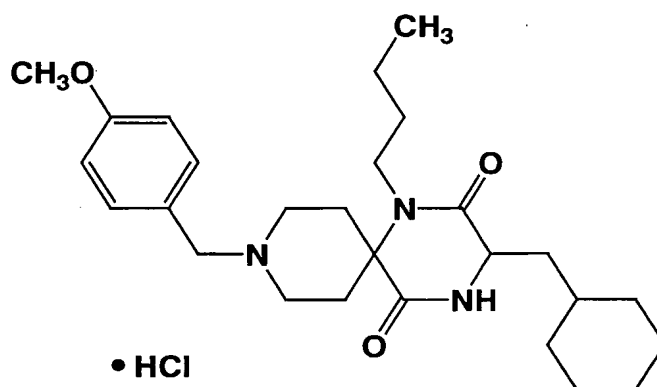
NMR (CD₃OD) : δ 7.55 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.18 (m, 1H), 7.05 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 3.79 (m, 2H), 3.60 - 3.30 (m, 4H),

20

2.46 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.95 - 1.40 (m, 5H), 0.94 (m, 9H)。

実施例 6 (2)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-メ
5 トキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカ
ン・塩酸塩

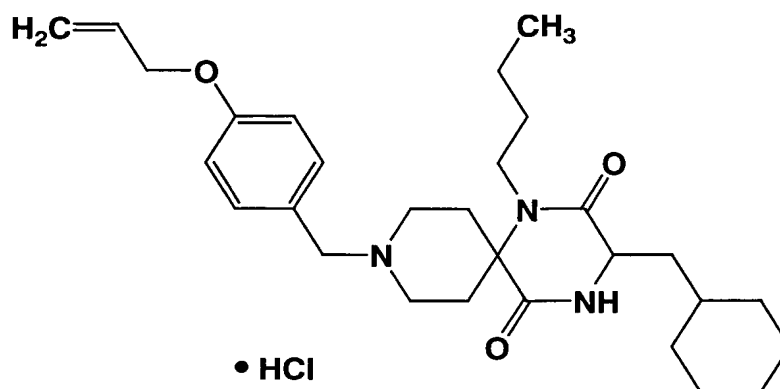


TLC : R_f 0.63 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 7.03 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 4.29 (s,
10 2H), 4.04 (dd, J = 7.6, 4.8 Hz, 1H), 3.83 (s, 3H), 3.74 (m, 2H), 3.55 - 3.35 (m,
4H), 2.41 (m, 2H), 2.15 (m, 2H), 1.85 - 1.55 (m, 7H), 1.55 - 1.42 (m, 3H), 1.42 -
1.30 (m, 3H), 1.30 - 1.10 (m, 2H), 1.08 - 0.80 (m, 5H)。

実施例 6 (3)

15 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(4-ア
リルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウン
デカン・塩酸塩

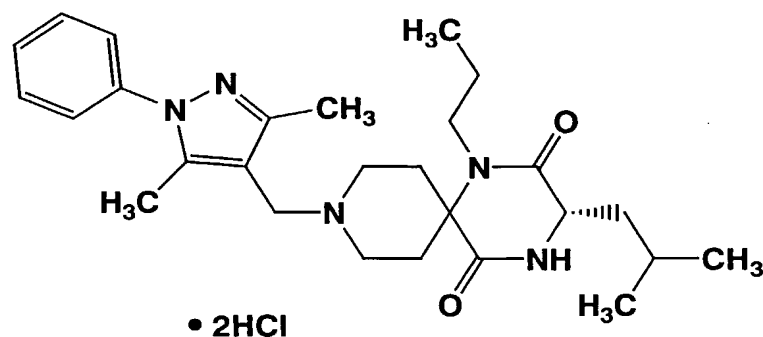


TLC : R_f 0.57 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.04 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.06 (m, 1H), 5.41 (m, 1H), 5.28 (m, 2H), 4.59 (m, 2H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.2, 4.8 Hz, 1H), 3.77 (m, 2H), 3.55 - 3.35 (m, 4H), 2.39 (m, 2H), 2.16 (m, 2H), 1.90 - 1.60 (m, 7H), 1.60 - 1.45 (m, 2H), 1.45 - 1.30 (m, 2H), 1.30 - 1.10 (m, 3H), 1.10 - 0.80 (m, 5H)。

実施例 6 (4)

- 10 (3S) - 1-プロピル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・二塩酸塩



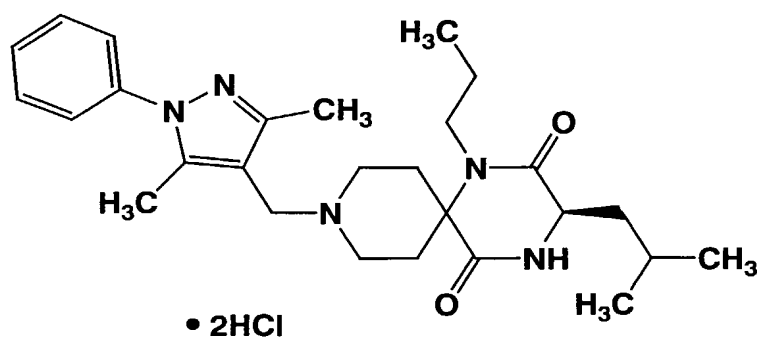
TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.65 - 7.45 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 5.2 Hz,

1H), 3.85 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 2.59 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.81 (m, 1H), 1.71 (m, 2H), 1.64 (m, 2H), 1.00 - 0.90 (m, 9H)。

5 实施例 6 (5)

(3R)-1-プロピル-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチル-1-プロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・二塩酸塩

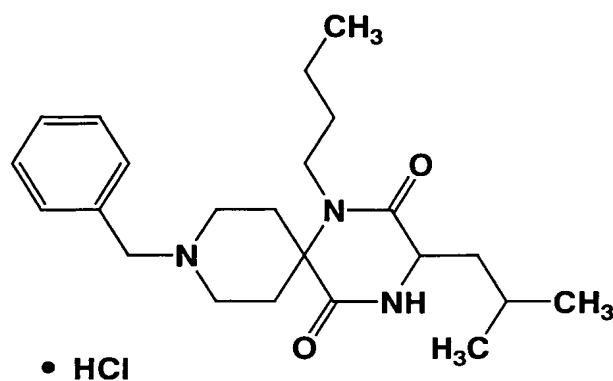


10 TLC : Rf 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.65 - 7.45 (m, 5H), 4.33 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 5.2 Hz, 1H), 3.85 (m, 2H), 3.62 (m, 2H), 3.44 (m, 2H), 2.59 (m, 2H), 2.43 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.20 (m, 2H), 1.81 (m, 1H), 1.71 (m, 2H), 1.64 (m, 2H), 1.00 - 0.90 (m, 9H)。

15

实施例 6 (6)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・塩酸塩

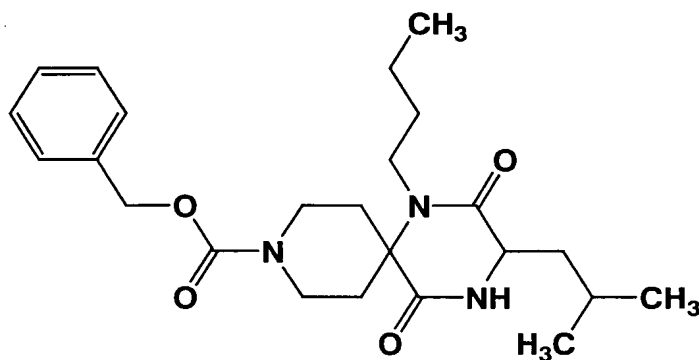


TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.64 - 7.44 (m, 5H), 4.36 (s, 2H), 4.01 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.77 (m, 2H), 3.55 - 3.35 (m, 4H), 2.60 - 2.30 (m, 2H), 2.17 (m, 2H), 1.95 - 1.75 (m, 1H), 1.75 - 1.60 (m, 2H), 1.60 - 1.45 (m, 2H), 1.45 - 1.20 (m, 2H), 1.10 - 0.80 (m, 9H)。

実施例 6 (7)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジ
 10 ルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

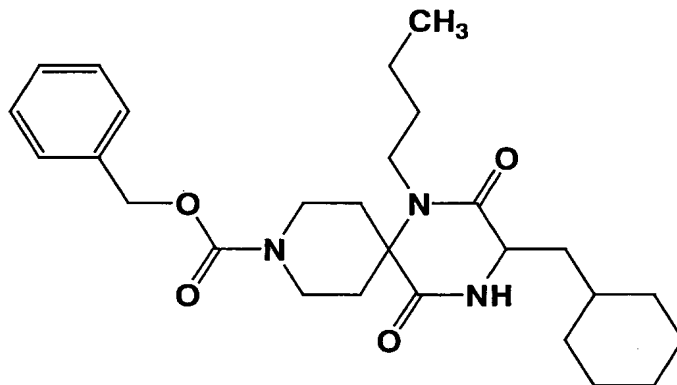


TLC : R_f 0.41 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CDCl₃) : δ 7.45-7.28 (m, 5H), 6.31 (m, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.14 (m, 2H), 3.96 (m, 1H), 3.63 (m, 1H), 3.44 (m, 1H), 3.26 (m, 2H), 1.99-1.14 (m, 11H),
 15 1.02-0.88 (m, 9H)。

実施例 6 (8)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-ベンジル
オキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン



5

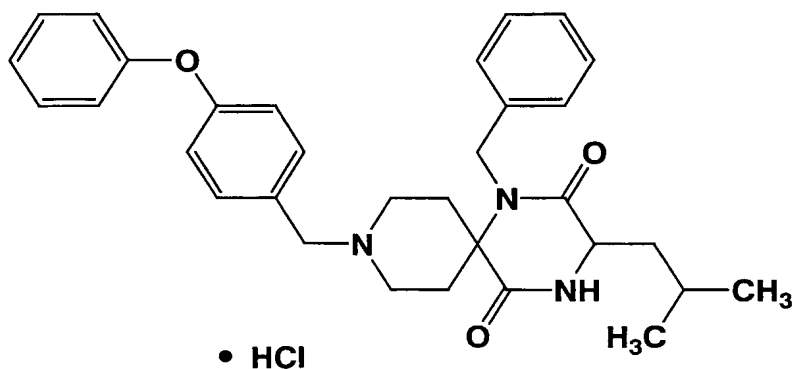
TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CDCl₃) : δ 7.40-7.29 (m, 5H), 5.98 (m, 1H), 5.15 (s, 2H), 4.14 (m, 2H), 4.00 (m, 1H), 3.65 (m, 1H), 3.43 (m, 1H), 3.26 (m, 2H), 2.03-1.81 (m, 4H), 1.80-1.60 (m, 5H), 1.60-1.10 (m, 10H), 1.10-0.85 (m, 5H)。

10

実施例 6 (9)

1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]
ウンデカン・塩酸塩



15

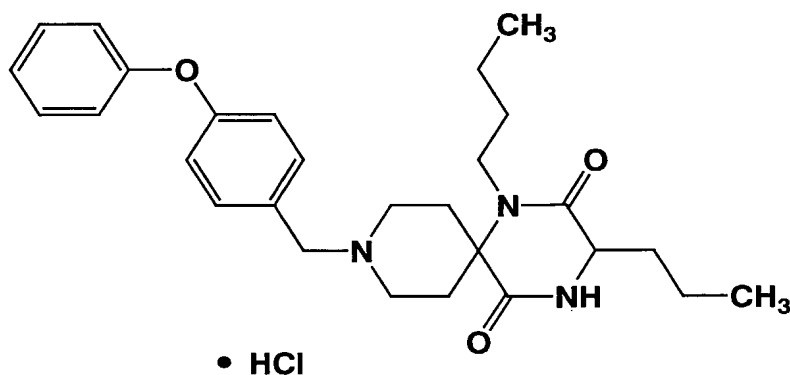
TLC : R_f 0.66 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.45 - 7.12 (m, 8H), 7.10 - 6.98 (m, 4H), 4.82 (m, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.18 (dd, J = 8.0, 4.6 Hz, 1H), 3.73 (m, 2H), 3.42 (m, 2H), 2.65 - 2.30 (m, 2H), 2.20 - 2.05 (m, 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.2 Hz, 6H)。

実施例 6 (10)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-プロピル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩

10 酸塩



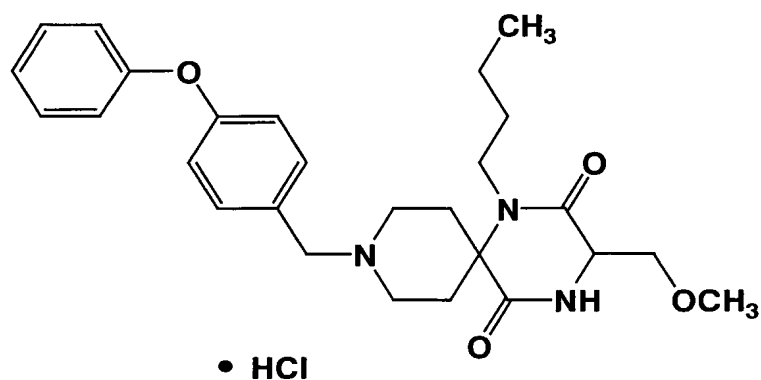
TLC : R_f 0.36 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 5.7, 4.5 Hz, 1H), 3.93-3.66 (m, 2H), 3.55-3.31 (m, 4H), 2.47-2.09 (m, 4H), 1.92-1.68 (m, 2H), 1.61-1.21 (m, 6H), 1.01-0.90 (m, 6H)。

実施例 6 (11)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-メトキシメチル-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカ

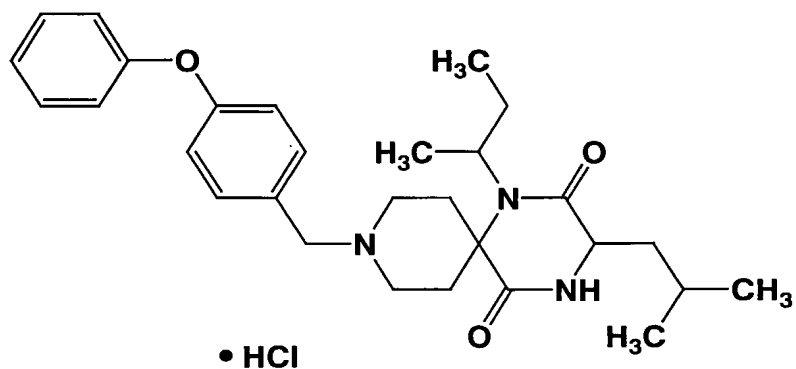
ン・塩酸塩

TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.2 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.09-6.99 (m, 4H), 4.30 (s, 2H), 4.07 (t, J = 3.0 Hz, 1H), 3.91 (m, 1H), 3.77 (dd, J = 9.0, 3.0 Hz, 1H), 3.67 (m, 1H), 3.58-3.39 (m, 4H), 3.31 (s, 3H), 3.26 (m, 1H), 2.48-2.13 (m, 4H), 1.65 (m, 1H), 1.53-1.28 (m, 3H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

10 実施例 6 (12)

1 - (1 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

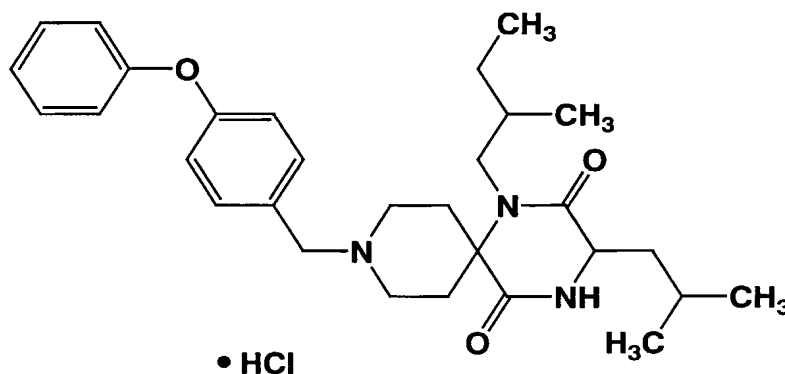


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.38 (dd, J = 8.4, 7.5 Hz, 2H), 7.16 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-6.99 (m, 4H), 4.15 (s, 2H), 3.91-3.82 (m, 1H), 3.81-3.65 (m, 1H), 3.64-3.44 (m, 1H), 3.44-3.15 (m, 3H), 2.42-2.00 (m, 4H), 1.88-1.56 (m, 5H), 1.46-1.37 (m, 3H), 0.99-0.85 (m, 9H)。

実施例 6 (13)

1 - (2-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



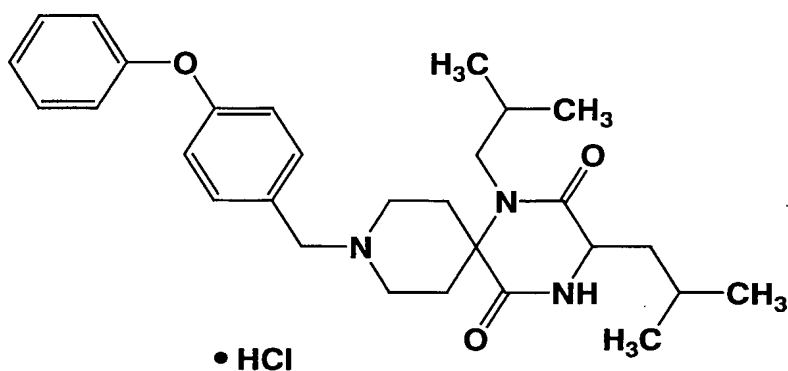
TLC : R_f 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.2 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.2 Hz, 1H), 7.08-6.94 (m, 4H), 4.27 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 8.4, 4.5 Hz, 1H), 3.83-3.21 (m, 6H), 2.45-2.12 (m, 4H), 1.92-1.56 (m, 4H), 1.42 (m, 1H), 1.14 (m, 1H), 1.00-0.83 (m, 12H)。

実施例 6 (14)

1 - (2-メチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩

スピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

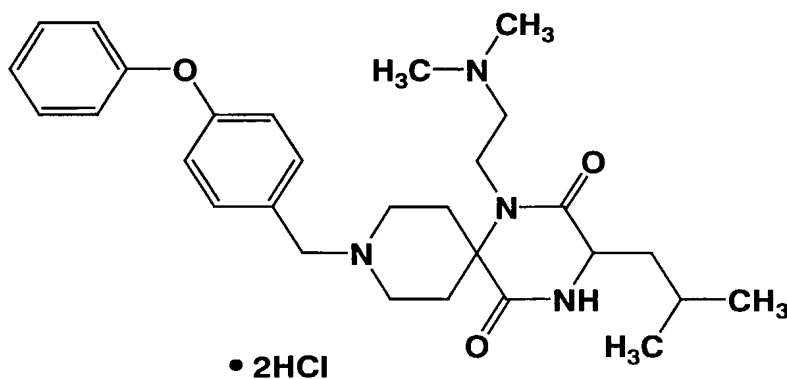


TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17
 5 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.13-7.04 (m, 4H), 4.28 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 8.1, 4.2 Hz, 1H),
 3.81-3.54 (m, 2H), 3.52-3.21 (m, 4H), 2.46-2.11 (m, 4H), 2.00-1.57 (m, 4H), 0.94
 (d, J = 6.3 Hz, 6H), 0.90 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.90 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 6 (15)

10 1 - (2 - ジメチルアミノエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチル
 プロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - ト
 リアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩



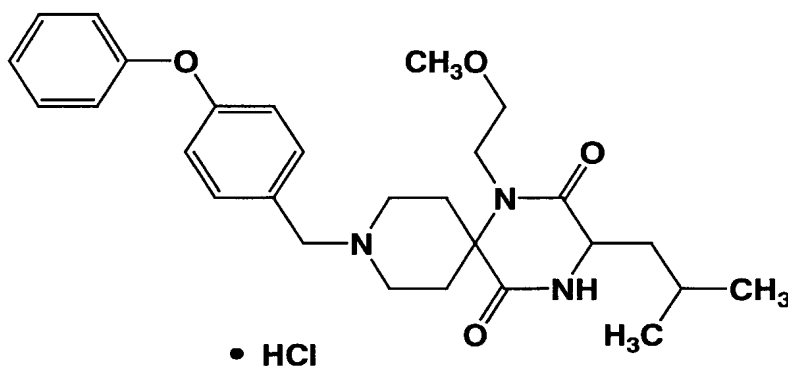
TLC : R_f 0.87 (クロロホルム : メタノール : 28%アンモニア水 = 80 :

1 0 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.60 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.07-6.99 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.07 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 3.99-3.63 (m, 4H), 3.53-3.42 (m, 2H), 3.32-3.21 (m, 2H), 2.99 (s, 3H), 2.96 (s, 3H), 2.70-2.49 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.93-1.56 (m, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 6H)。

実施例 6 (16)

10 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



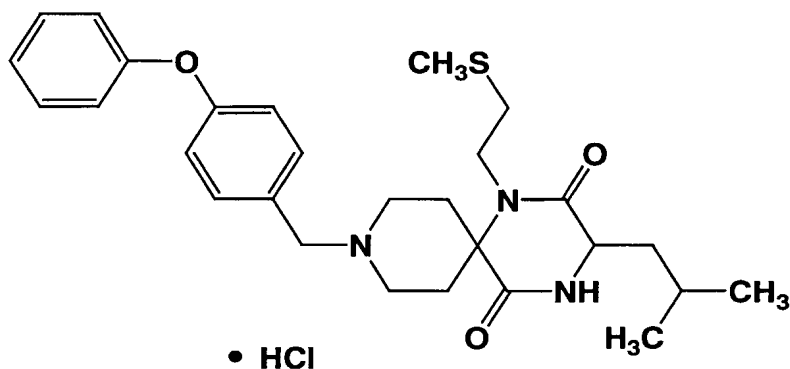
TLC : R_f 0.40 (クロロホルム : メタノール = 1 0 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-6.99 (m, 4H), 4.25 (s, 2H), 4.03 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.75-3.34 (m, 8H), 3.31 (s, 3H), 2.48-2.28 (m, 2H), 2.25-2.06 (m, 2H), 1.90-1.57 (m, 3H), 0.94 (d, J = 6.3 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.3 Hz, 3H)。

実施例 6 (17)

20 1 - (2 - メチルチオエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロ

ピル) - 9 - (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

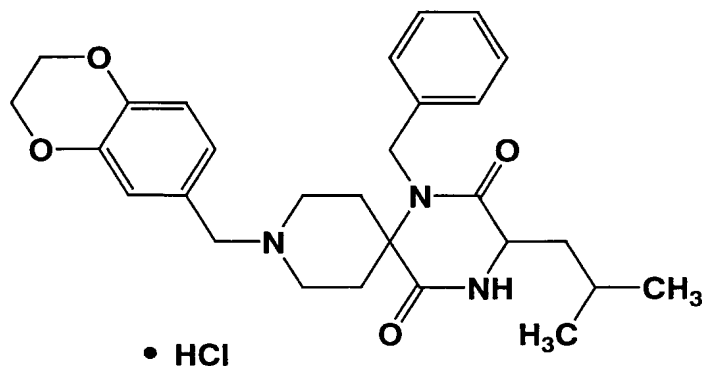


TLC : R_f 0.43 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.48 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.8 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.08-6.99 (m, 4H), 4.25 (s, 2H), 4.02 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.81-3.49 (m, 4H), 3.48-3.33 (m, 2H), 2.74-2.51 (m, 2H), 2.39-2.10 (m, 7H), 1.90-1.56 (m, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

10 実施例 6 (18)

1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



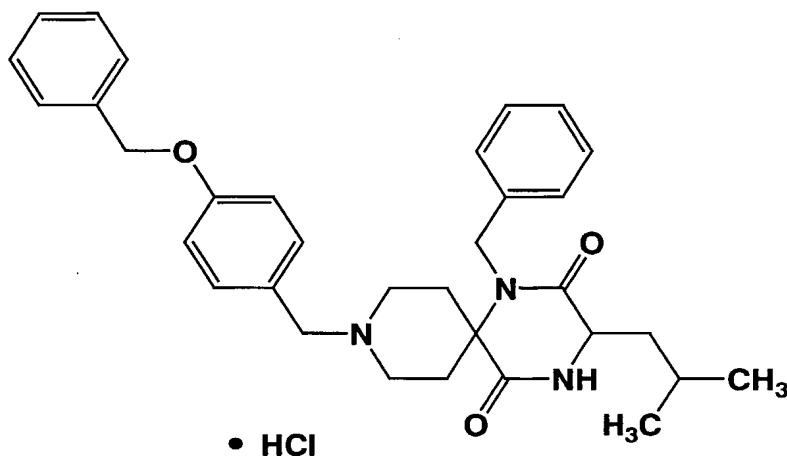
- 15 TLC : R_f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.15 (m, 5H), 7.03 (d, J = 2.0 Hz, 1H), 6.96 (dd, J = 8.2, 2.0 Hz, 1H), 6.90 (d, J = 8.2 Hz, 1H), 4.80 (m, 2H), 4.25 (s, 4H), 4.21 - 4.10 (m, 3H), 3.80 - 3.55 (m, 2H), 3.50 - 3.30 (m, 2H), 2.60 - 2.25 (m, 2H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.4 Hz, 6H)。

5

実施例 6 (19)

1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



10

TLC : R_f 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

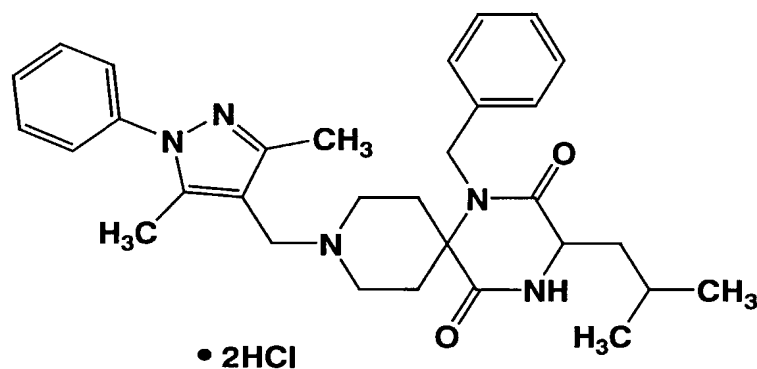
NMR (CD₃OD) : δ 7.50 - 7.15 (m, 12H), 7.07 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 5.12 (s, 2H), 4.81 (m, 2H), 4.24 (s, 2H), 4.17 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 3.70 - 3.55 (m, 2H), 3.50 - 3.35 (m, 2H), 2.60 - 2.25 (m, 2H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.98 (d, J = 6.0 Hz, 6H)。

15

実施例 6 (20)

1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-

トリアザスピロ〔5. 5〕ウンデカン・二塩酸塩

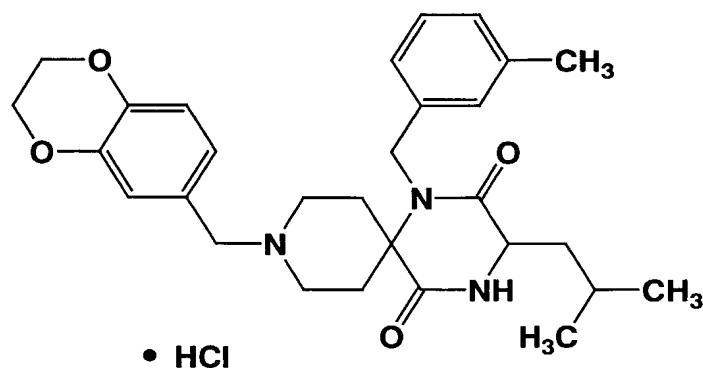


TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.70 - 7.45 (m, 5H), 7.40 - 7.15 (m, 5H), 4.92 (m, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.20 (dd, J = 8.4, 4.8 Hz, 1H), 3.90 - 3.65 (m, 2H), 3.65 - 3.45 (m, 2H), 2.85 - 2.50 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.39 (s, 3H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 1.00 (d, J = 5.4 Hz, 6H)。

実施例 6 (21)

10 1 - (3 - メチルフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ〔5. 5〕ウンデカン・塩酸塩



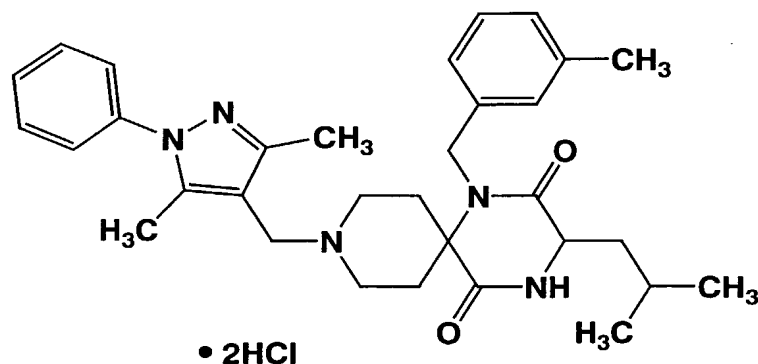
TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.18 (t, J = 7.8 Hz, 1H), 7.10 - 6.85 (m, 6H), 4.77 (m, 2H),

4.25 (s, 4H), 4.19 (m, 3H), 3.68 (m, 2H), 3.40 (m, 2H), 2.60 - 2.30 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.20 - 2.00 (m, 2H), 2.00 - 1.60 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.2 Hz, 6H)。

実施例 6 (2 2)

- 5 1 - (3 - メチルフエニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3, 5 - ジメチル - 1 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩

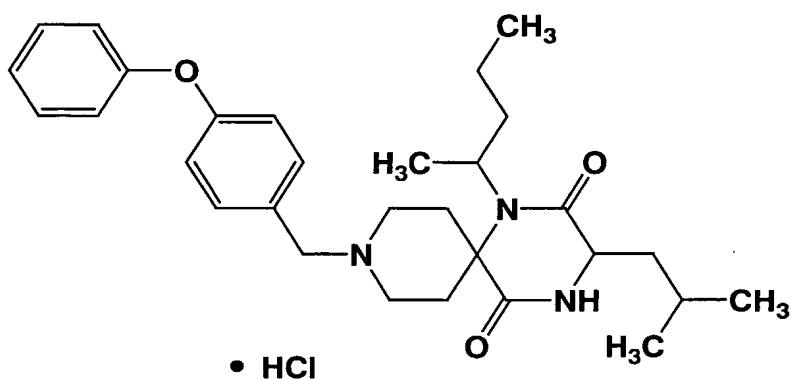


TLC : R_f 0.59 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.70 - 7.45 (m, 5H), 7.18 (t, J = 7.4 Hz, 1H), 7.10 - 7.00 (m, 3H), 4.88 (s, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.20 (dd, J = 8.2, 4.8 Hz, 1H), 3.76 (m, 2H), 3.60 (m, 2H), 2.90 - 2.50 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.41 (s, 3H), 2.30 (s, 3H), 2.10 (m, 2H), 1.88 (m, 1H), 1.85 - 1.65 (m, 2H), 1.00 (d, J = 5.8 Hz, 6H)。

15 実施例 6 (2 3)

1 - (1 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

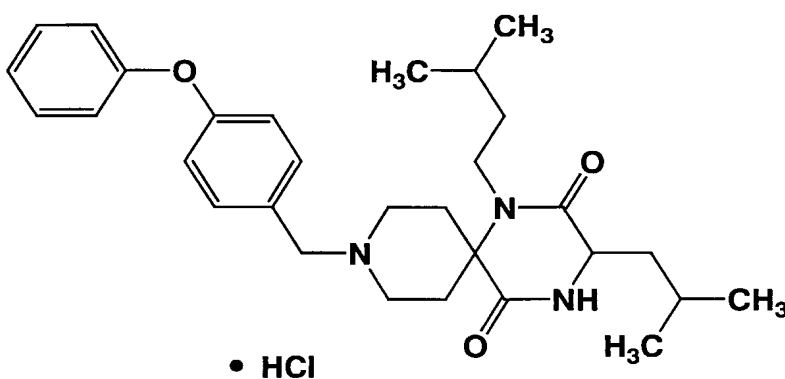


TLC : R_f 0.49, 0.56 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.49 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.08-6.99 (m, 4H), 4.26 (s, 2H), 3.97-3.79 (m, 2H), 3.78-3.60 (m, 1H), 3.54-3.33 (m, 3H), 2.47-2.29 (m, 2H), 2.26-2.03 (m, 3H), 1.87-1.71 (m, 1H), 1.70-1.53 (m, 3H), 1.48-1.16 (m, 5H), 1.02-0.90 (m, 9H)。

実施例 6 (24)

1- (3-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ-3- (2-メチルプロピル) - 9- (4-フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



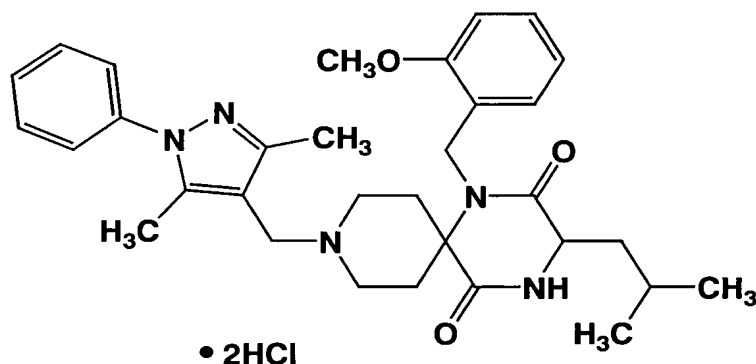
TLC : R_f 0.54 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.00 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H),

3.90-3.71 (m, 2H), 3.56-3.34 (m, 4H), 2.46-2.29 (m, 2H), 2.28-2.10 (m, 2H), 1.90-1.56 (m, 4H), 1.55-1.32 (m, 2H), 1.04-0.85 (m, 12H)。

実施例 6 (25)

- 5 1 - (2 - メトキシフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((3, 5 - ジメチル - 1 - フェニル) - 4 - ピラゾリル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩

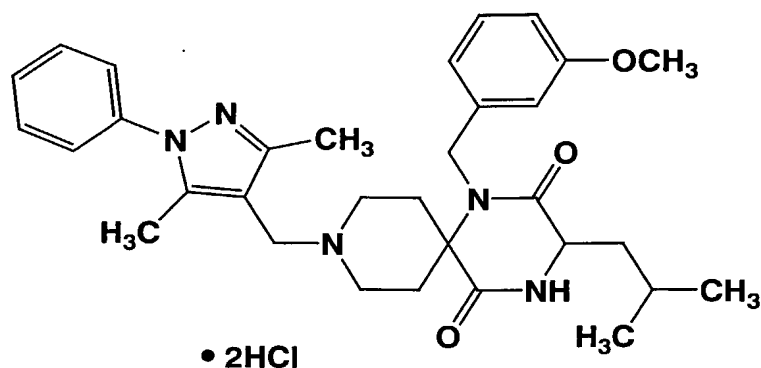


- 10 TLC : R_f 0.38 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.59-7.41 (m, 5H), 7.26-7.17 (m, 1H), 6.99-6.84 (m, 3H), 4.74 (brs, 2H), 4.27 (s, 2H), 4.19 (dd, J = 8.4, 4.5 Hz, 1H), 3.88 (s, 3H), 3.90-3.68 (m, 2H), 3.62-3.45 (m, 2H), 2.60-2.14 (m, 4H), 2.35 (s, 3H), 2.33 (s, 3H), 2.00-1.63 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.3 Hz, 6H)。

15

実施例 6 (26)

- 1 - (3 - メトキシフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - ((3, 5 - ジメチル - 1 - フェニル) - 4 - ピラゾリル) メチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二塩酸塩
- 20 塩

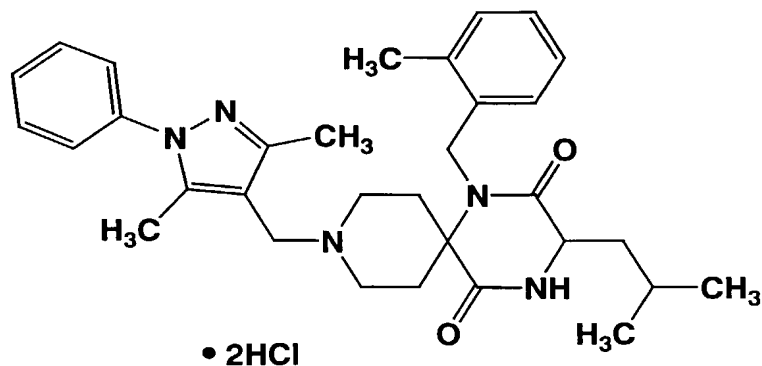


TLC : R_f 0.33 (クロロホルム：メタノール=20：1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.65-7.48 (m, 5H), 7.20 (t, J = 8.1 Hz, 1H), 6.85-6.80 (m, 2H), 6.77 (dd, J = 7.8, 2.1 Hz, 1H), 4.90 (brs, 2H), 4.31 (s, 2H), 4.20 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.84-3.65 (m, 2H), 3.75 (s, 3H), 3.65-3.48 (m, 2H), 2.84-2.56 (m, 2H), 2.47 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.19-2.03 (m, 2H), 2.00-1.65 (m, 3H), 0.99 (d, J = 6.3 Hz, 6H)。

实施例 6 (27)

10 1-(2-メチルフェニルメチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン・二塩酸塩



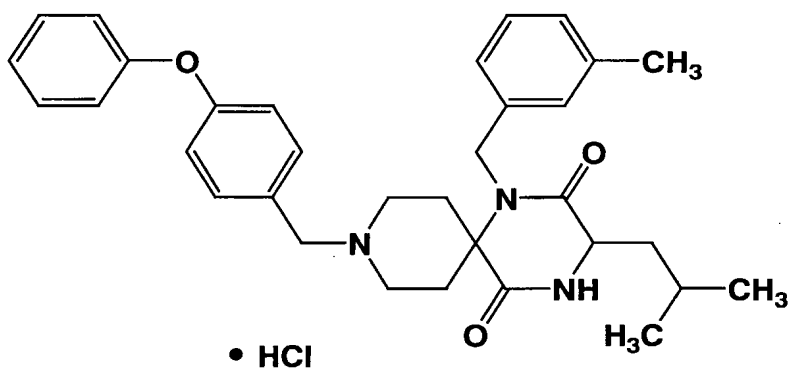
TLC : R_f 0.35 (クロロホルム：メタノール=20：1)；

15 NMR (CD₃OD) : δ 7.63-7.46 (m, 5H), 7.18-7.06 (m, 3H), 6.99-6.91 (m, 1H),

4.81 (brs, 2H), 4.29 (s, 2H), 4.20 (dd, $J = 8.4, 4.5$ Hz, 1H), 3.90-3.66 (m, 2H), 3.63-3.57 (m, 2H), 2.75-2.40 (m, 2H), 2.44 (s, 3H), 2.40 (s, 3H), 2.38 (s, 3H), 2.30-2.10 (m, 2H), 2.00-1.65 (m, 3H), 0.99 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H)。

5 実施例 6 (28)

1 - (3 - メチルフェニルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

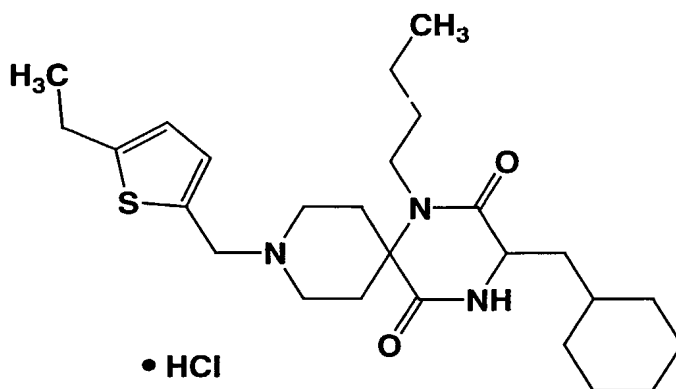


- 10 TLC : R_f 0.48 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.53-7.46 (m, 2H), 7.42-7.36 (m, 2H), 7.22-7.14 (m, 2H), 7.06-6.96 (m, 7H), 4.85-4.65 (m, 2H), 4.28 (s, 2H), 4.18 (dd, $J = 8.1, 4.5$ Hz, 1H), 3.80-3.62 (m, 2H), 3.50-3.30 (m, 2H), 2.58-2.25 (m, 2H), 2.29 (s, 3H), 2.18-2.04 (m, 2H), 1.95-1.62 (m, 3H), 0.98 (d, $J = 6.3$ Hz, 6H)。

15

実施例 6 (29)

1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - シクロヘキシルメチル - 9 - (5 - エチルチオフェン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩

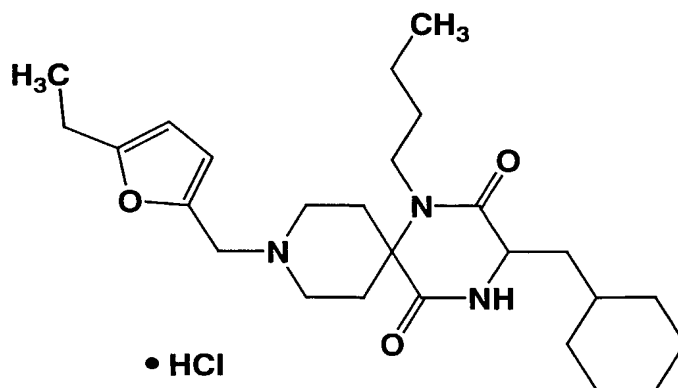


TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.17 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 6.85 (d, J = 3.6 Hz, 1H), 4.53 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.8, 4.5 Hz, 1H), 3.88-3.72 (m, 2H), 3.58-3.45 (m, 2H), 3.43-3.33 (m, 2H), 2.87 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.08 (m, 2H), 1.83-1.10 (m, 17H), 1.31 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.05-0.85 (m, 2H), 0.95 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 6 (30)

- 10 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(5-エチルフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

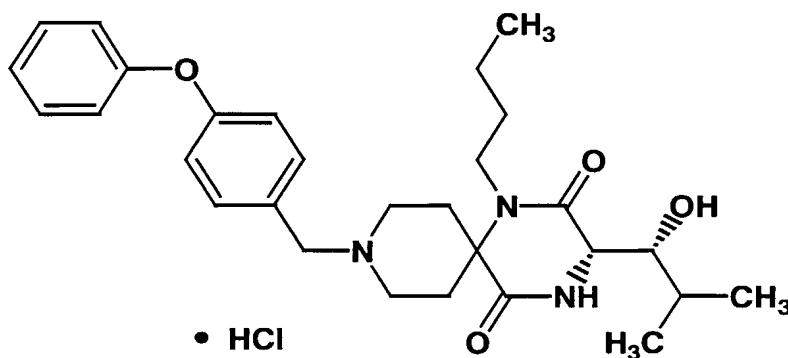


TLC : R_f 0.62 (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 6.63 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 6.14 (d, J = 3.0 Hz, 1H), 4.39 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 7.5, 4.5 Hz, 1H), 3.90-3.70 (m, 2H), 3.55-3.40 (m, 2H), 3.40-3.35 (m, 2H), 2.69 (q, J = 7.5 Hz, 2H), 2.50-2.30 (m, 2H), 2.30-2.10 (m, 2H), 1.85-1.05 (m, 17H), 1.25 (t, J = 7.5 Hz, 3H), 1.05-0.85 (m, 2H), 0.96 (t, J = 7.5 Hz, 3H)。

実施例 6 (3 1)

(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 R) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) -
10 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5 . 5] ウンデカン ・ 塩酸塩

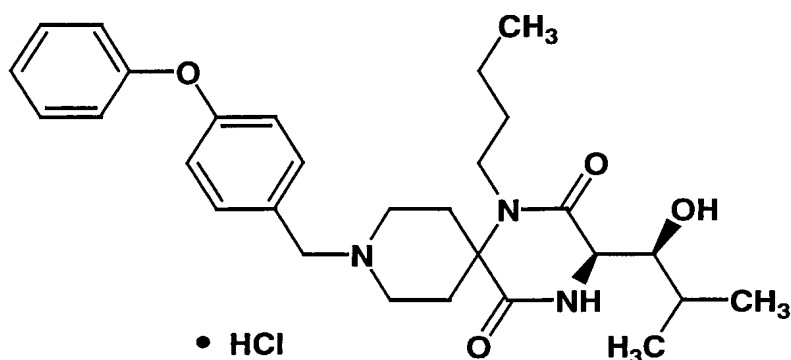


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.16-4.00 (m, 2H), 3.75-3.40 (m, 5H),
15 3.26-3.09 (m, 1H), 2.56-2.08 (m, 4H), 1.82-1.60 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.05-0.89 (m, 9H)。

実施例 6 (3 2)

(3 R) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ((1 S) - 1 - ヒドロキシ - 2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) -
20

1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

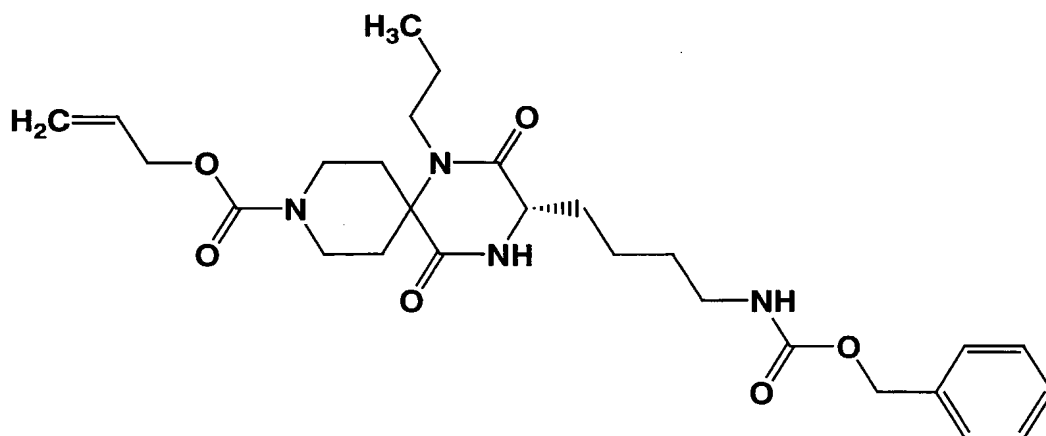


TLC : R_f 0.47 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.52 (d, J = 9.0 Hz, 2H), 7.44-7.35 (m, 2H), 7.18 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.10-7.00 (m, 4H), 4.33 (s, 2H), 4.16-4.00 (m, 2H), 3.75-3.40 (m, 5H), 3.26-3.09 (m, 1H), 2.56-2.08 (m, 4H), 1.82-1.60 (m, 2H), 1.50-1.30 (m, 3H), 1.05-0.89 (m, 9H)。

実施例 7

- 10 (3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-アリルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

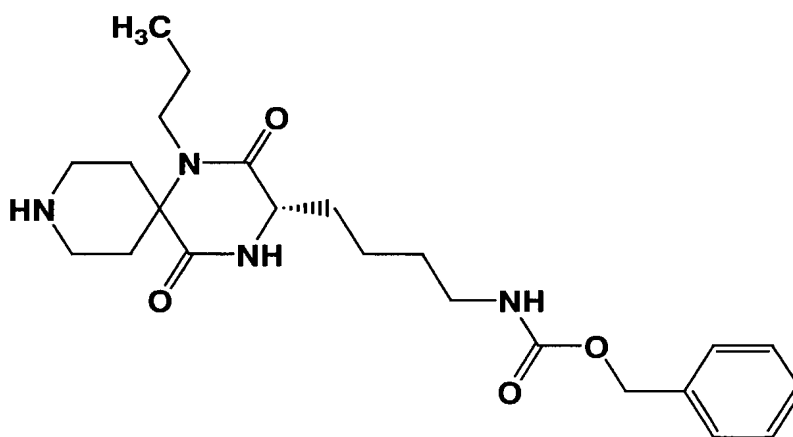


参考例 8 で製造した樹脂 (6)、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン、n-プロピルアミンおよびN-(t-ブチルオキシカルボニル)-N'-(ベンジルオキシカルボニル)-L-リジンを用いて、参考例 9 → 参考例 10 → 実施例 1 と同様の操作をして、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC: R_f 0.24 (酢酸エチル: ヘキサン = 4: 1) ;
 NMR (CD₃OD): δ 7.35 (m, 5H), 6.40 (m, 1H), 5.96 (ddt, J = 17.2, 10.2, 5.6 Hz, 1H), 5.34 (m, 1H), 5.24 (m, 1H), 5.12 (s, 2H), 4.88 (m, 1H), 4.62 (m, 2H), 4.10 (m, 2H), 4.00 (m, 1H), 3.75 (m, 1H), 3.36 (m, 2H), 3.18 (m, 3H), 1.94 (m, 6H),
 10 1.51 (m, 6H), 0.90 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 8

(3S)-1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]
 15 ウンデカン



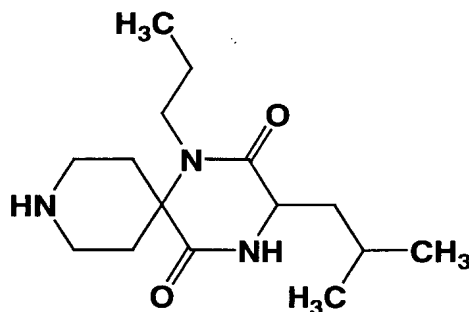
実施例 7 で製造した化合物を用いて、参考例 4 と同様の操作をし、さらに陽イオン交換樹脂およびシリカゲルカラムクロマトグラフィーによって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC : R_f 0.56 (クロロホルム : メタノール : 28%アンモニア水 = 20 : 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.20 (m, 10H), 5.06 (s, 2H), 4.03 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.55-3.18 (m, 4H), 3.12 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.08-2.98 (m, 2H), 2.20-1.70 (m, 6H), 1.70-1.20 (m, 6H), 0.93 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 8 (1)

1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



N-(t-ブチルオキシカルボニル)-N'-(ベンジルオキシカルボニル)-L-リジンの代わりにN-(t-ブチルオキシカルボニル)ロイシンを用いて、実施例7→実施例8と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

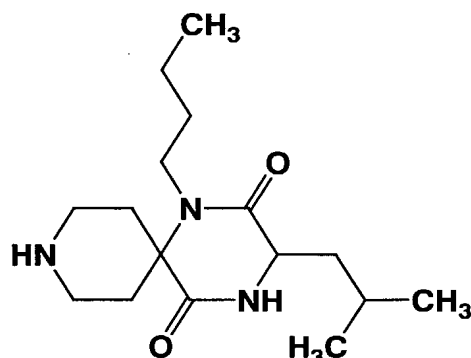
TLC : R_f 0.44 (クロロホルム : メタノール : トリエチルアミン = 18 : 2 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 3.99 (d, J = 7.8, 4.4 Hz, 1H), 3.50-3.20 (m, 4H), 3.05-2.85 (m, 2H), 2.10-1.75 (m, 5H), 1.75-1.40 (m, 4H), 1.00-0.85 (m, 9H)。

20 実施例 9

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9

ートリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



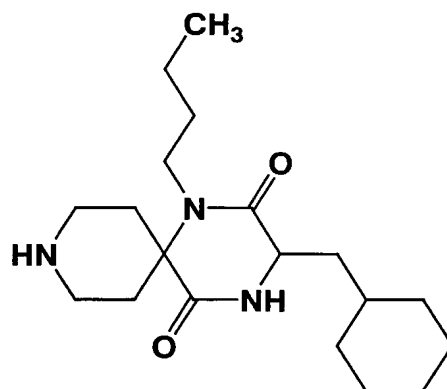
実施例 6 (7) で製造した化合物 (202 mg) のメタノール (5 ml) 溶液に、5 %パラジウム-炭素 (20 mg) を加えた。反応混合物を水素雰囲気下、室温で3時間攪拌した。反応混合物をセライト (商品名) を通してろ過し、ろ液を濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (127 mg) を得た。

TLC: Rf 0.61 (クロロホルム:メタノール:28%アンモニア水=20:5:1) ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 3.97 (dd, J = 7.8 Hz, 4.5 Hz, 1H), 3.48-3.22 (m, 4H), 3.00-2.90 (m, 2H), 2.12-1.60 (m, 11H), 0.95 (t, J = 7.2 Hz, 3H), 0.94 (d, J = 6.6 Hz, 3H), 0.93 (d, J = 6.6 Hz, 3H)。

実施例 9 (1)

15 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-1, 4, 9-ートリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



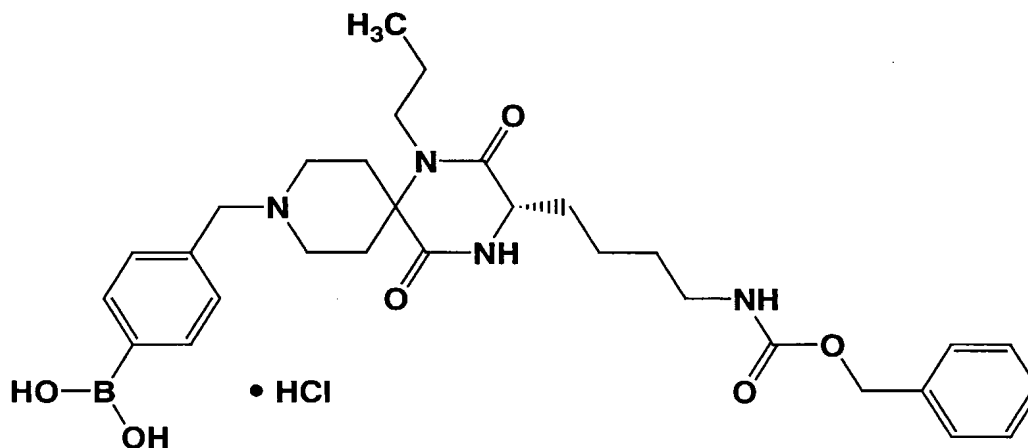
実施例 6 (7) で製造した化合物の代わりに、実施例 6 (8) で製造した化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 5 TLC : R_f 0.65 (クロロホルム : メタノール : 28%アンモニア水 = 20 : 5 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 4.00 (dd, J = 7.8 Hz, 4.5 Hz, 1H), 3.46-3.24 (m, 4H), 3.03-2.92 (m, 2H), 2.08-1.08 (m, 19H), 1.05-0.84 (m, 5H)。

10 実施例 10

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (4 - ジヒドロキシボランフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



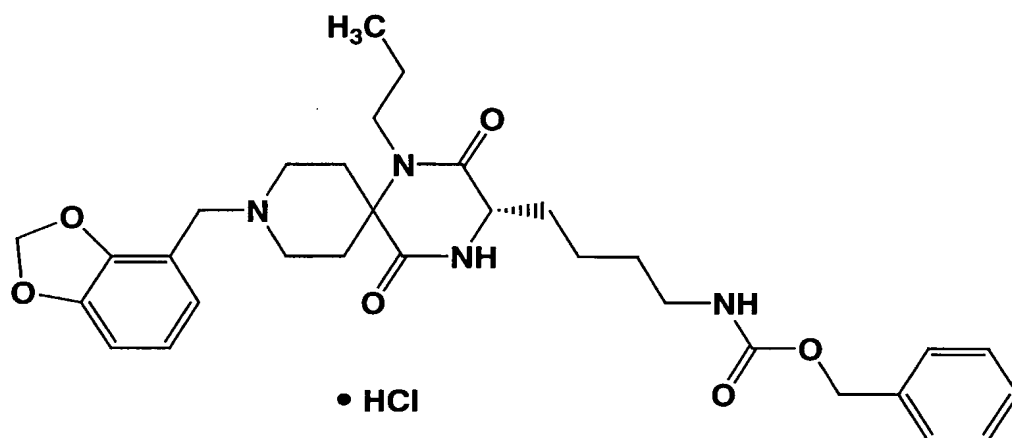
実施例 8 で製造した化合物 (70 mg) を 1 % 酢酸のジメチルホルムアミド溶液 (2 ml) に溶解した。この溶液に、水素化トリアセトキシホウ素ナトリウム (46 mg) と 4-ホルミルフェニルボロン酸 (30 mg) を加えた。反応混合物を室温で 46 時間攪拌した。反応混合物に 10 % 酢酸のメタノール溶液を加えた。この溶液を、陽イオン交換樹脂 (ボンドエルトー SCX、バリアン社、0.6mm φ 1 / g、500 mg / 3 ml) に通し、メタノールで洗浄した。さらに、10 % トリエチルアミンのメタノール溶液で溶出した。この 10 % トリエチルアミンのメタノール溶液で溶出した溶液だけを濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 1 : 0 → 30 : 1 → 10 : 1) によって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物 (45 mg) を得た。

TLC : R_f 0.24 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.73 (br, 2H), 7.52 (br, 2H), 7.32 (m, 5H), 5.03 (s, 2H), 4.36 (s, 2H), 4.05 (t, J=4.8 Hz, 1H), 3.81 (m, 2H), 3.46 (m, 3H), 3.10 (t, J=6.6 Hz, 2H), 2.37 (br, 2H), 2.22 (br, 2H), 1.92-1.66 (m, 2H), 1.60-1.28 (m, 7H), 0.91 (t, J=7.5 Hz, 3H)。

実施例 10 (1)

(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) -9-(1, 3-ベンゾジオキサラン-4-イルメチル) -1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



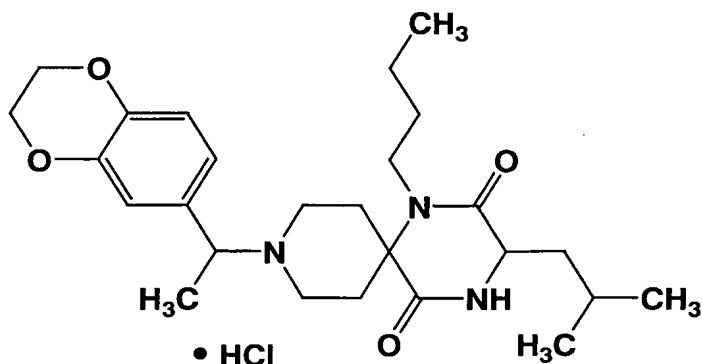
4-ホルミルフェニルボロン酸の代わりに、2,3-(メチレンジオキシ)ベンゾアルデヒドを用いて、実施例10と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 5 TLC: R_f 0.25 (クロロホルム:メタノール=10:1);
 NMR (CD₃OD): δ 7.32 (m, 5H), 6.96 (m, 3H), 6.05 (s, 2H), 5.04 (s, 2H), 4.33 (s, 2H), 4.05 (t, J=4.5 Hz, 1H), 3.98-3.54 (m, 2H), 3.53 (m, 2H), 3.38 (m, 3H), 3.11 (t, J=6.6 Hz, 2H), 2.37 (br, 2H), 2.22 (br, 2H), 1.98-1.76 (m, 2H), 1.61-1.28 (m, 5H), 0.92 (t, J=7.2 Hz, 3H)。

10

実施例 11

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-(1,4-ベンゾジオキサネ-6-イル)エチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



実施例 9 で製造した化合物 (315 mg) のジクロロメタン (5 ml) 溶液に、アルゴン雰囲気下、1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル メチル ケトン (285 mg)、トリエチルアミン (0.354 ml)、四塩化チタンのジクロロメタン溶液 (1.0M 溶液、0.63 ml) を加えた。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物にシアノ水素化ホウ素ナトリウム (133 mg) のメタノール (2 ml) 溶液を加えた。反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物に 2 N 水酸化ナトリウム水溶液を加え、酢酸エチルで抽出した。抽出物を無水硫酸ナトリウムで乾燥し、濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (富士シリシア化学、BW235; クロロホルム: メタノール = 50:1) によって精製した。得られた残渣をメタノールに溶解し、1 N 塩酸水溶液で酸性にし、濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (176 mg) を得た。

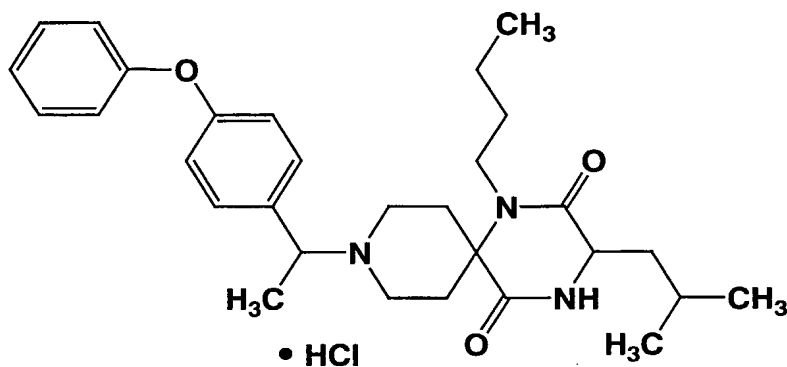
TLC: R_f 0.46 (クロロホルム: メタノール = 10:1);

¹H NMR (CD₃OD): δ 7.04 (d, J = 2.1 Hz, 1H), 6.98 (dd, J = 8.4, 2.1 Hz, 1H), 6.92 (d, J = 8.4 Hz, 1H), 4.40 (q, J = 6.9 Hz, 1H), 4.26 (s, 4H), 3.98 (dd, J = 8.1, 4.5 Hz, 1H), 3.82-3.17 (m, 6H), 2.55-2.04 (m, 4H), 1.87-1.28 (m, 10H), 1.04-0.85 (m, 9H)。

20 実施例 11 (1)

1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-

(4-フェニルオキシフェニル)エチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩



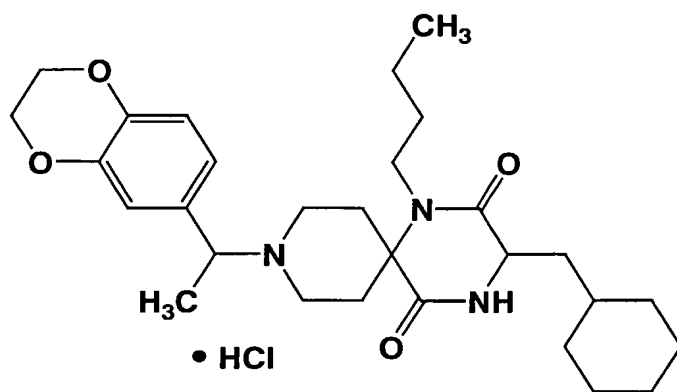
1,4-ベンゾジオキサン-6-イルメチルケトンの代わりに、4-フェノキシアセトフェノンを用いて、実施例11と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC: R_f 0.58, 0.62 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.51 (d, J = 8.7 Hz, 2H), 7.39 (dd, J = 8.7, 7.5 Hz, 2H), 7.17 (t, J = 7.5 Hz, 1H), 7.09-7.01 (m, 4H), 4.48 (m, 1H), 3.98 (dd, J = 7.8, 4.8 Hz, 1H), 3.80-3.17 (m, 6H), 2.56-2.28 (m, 2H), 2.28-2.03 (m, 2H), 1.88-1.24 (m, 7H), 1.76 (d, J = 6.9 Hz, 3H), 1.04-0.86 (m, 9H)。

実施例12

1-ブチル-2,5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-(1-(1,4-ベンゾジオキサン-6-イル)エチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・塩酸塩

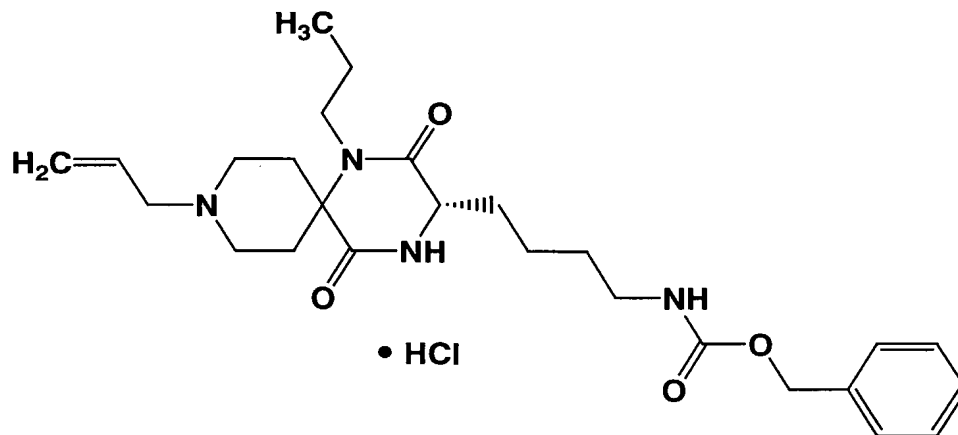


実施例 9 で製造した化合物の代わりに、実施例 9 (1) で製造した化合物を用いて、実施例 11 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

- 5 TLC : R_f 0.50 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD_3OD) : δ 7.02 (d, $J = 1.8$ Hz, 1H), 6.96 (dd, $J = 8.4, 1.8$ Hz, 1H), 6.92 (d, $J = 8.4$ Hz, 1H), 4.39 (m, 1H), 4.26 (s, 4H), 4.01 (dd, $J = 7.5, 4.5$ Hz, 1H), 3.80-3.20 (m, 6H), 2.50-2.02 (m, 4H), 1.82-1.13 (m, 18H), 1.04-0.83 (m, 5H)。

10 実施例 13

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - アリル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5.5] ウンデカン・塩酸塩



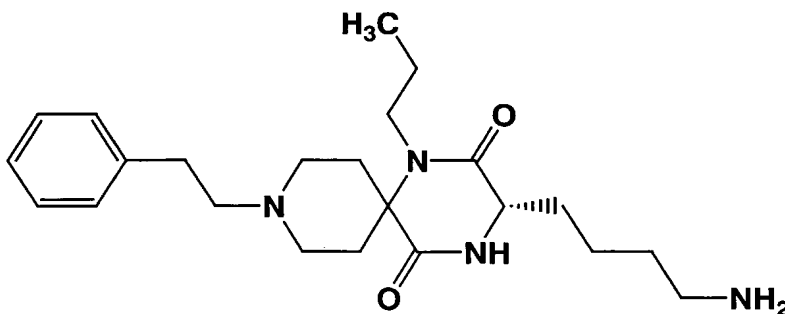
実施例 7 で製造した化合物 (225 mg) のテトラヒドロフラン (5 ml) 溶液に、アルゴン雰囲気下、室温で、テトラキストリフェニルホスフィンパラジウム (0) (51 mg) を加えた。反応混合物を室温で 16 時間攪拌した。反応混合物を、陽イオン交換樹脂 (ボンドエルトー SCX、バリアン社、0.6mm φ 1 / g、500 mg / 3 ml) に通し、メタノールで洗浄した。さらに、10% トリエチルアミンのメタノール溶液 (20 ml) で溶出した。この 10% トリエチルアミンのメタノール溶液で溶出した溶液だけを濃縮した。得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー (クロロホルム : メタノール = 20 : 1) によって精製し、以下の物性値を有する本発明化合物 (122 mg) を得た。

TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.34 (m, 5 H), 6.00 (m, 1 H), 5.62 (m, 1 H), 5.61 (m, 1 H), 5.06 (s, 2 H), 4.07 (t, J = 5.2 Hz, 1 H), 3.77 (m, 4 H), 3.44 (m, 4 H), 3.12 (t, J = 6.6 Hz, 2 H), 2.39 (m, 2 H), 2.20 (m, 2 H), 1.84 (m, 2 H), 1.54 (m, 4 H), 1.37 (m, 2 H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3 H)。

実施例 14

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - アミノブチル) - 9 - フェニルエチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



実施例 6 (7) で製造した化合物の代わりに、実施例 5 (11) で製造し

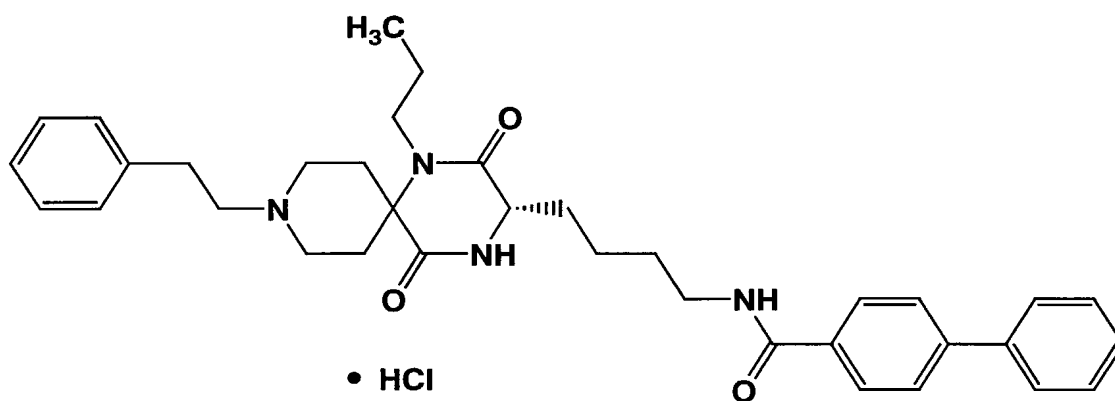
た化合物を用いて、実施例 9 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物を得た。

TLC: R_f 0.66 (クロロホルム: メタノール: 28%アンモニア水 = 20 : 5 : 1) ;

- 5 NMR (CD₃OD) : δ 7.23 (m, 5H), 4.05 (t, J = 5.2 Hz, 1H), 3.42 (m, 2H), 2.98 (m, 3H), 2.81 (m, 3H), 2.65 (m, 4H), 2.16 (m, 2H), 1.99 (m, 1H), 1.89 (m, 3H), 1.53 (m, 3H), 1.48 (m, 3H), 0.94 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 15

- 10 (3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - (4 - フェニル) フェニルカルボニル) アミノプロチル) - 9 - フェニルエチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・塩酸塩



- 15 実施例 14 で製造した化合物 (42 mg) のジクロロエタン (2 ml) 溶液に、ジイソプロピルエチルアミン (35 μ l) と 4 - フェニルベンゾイルクロライド (33 mg) を加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物を、陽イオン交換樹脂 (ボンドエルトー SCX、バリアン社、0.6 mmol / g、500 mg / 3 ml) に通し、メタノールで洗浄した。さらに、10% トリエチルアミンのメタノール溶液 (20 ml) で溶出した。この 10% トリエチルアミンのメタノール溶液で溶出した溶液だけを濃縮した。
- 20

得られた残渣をシリカゲルカラムクロマトグラフィー（クロロホルム：メタノール＝１０：０→１０：１）によって精製した。得られた生成物に４Ｎ塩酸の酢酸エチル溶液を加え、以下の物性値を有する本発明化合物（６６ｍｇ）を得た。

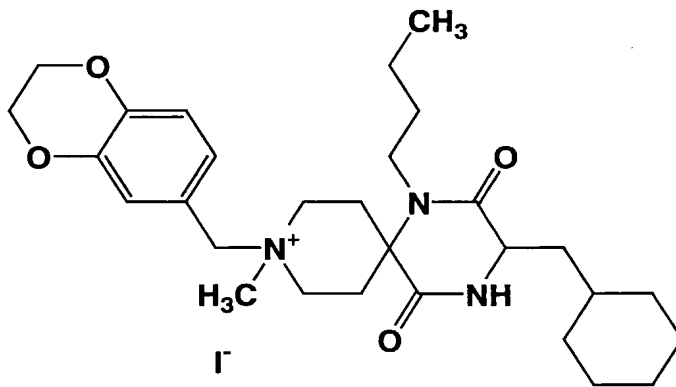
5 TLC : R_f 0.50 (クロロホルム：メタノール＝１０：１) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.89 (d, J=8.1 Hz, 2H), 7.72 (d, J=8.1 Hz, 2H), 7.65 (d, J=7.2 Hz, 2H), 7.45 (t, J=7.2 Hz, 2H), 7.39-7.26 (m, 6H), 4.11 (m, 1H), 3.86-3.71 (m, 2H), 3.63-3.53 (m, 2H), 3.45-3.30 (m, 4H), 3.07 (m, 2H), 2.42 (br, 2H), 2.19 (m, 2H), 1.99-1.78 (m, 2H), 1.68-1.28 (m, 7H), 0.86 (t, J=7.5 Hz, 3H)。

10

実施例 1 6

ヨウ化 1-ブチル-2, 5-ジオキソ-3-シクロヘキシルメチル-9-メチル-9-(1-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イル)エチル)-1, 4, -ジアザ-9-アゾニアスピロ[5. 5]ウンデカン



15

実施例 2 (1) で製造した化合物 (50 mg) のクロロホルム (2 ml) 溶液に、1 N 水酸化ナトリウム (2 ml) を加えた。反応混合物を室温で 10 分間攪拌した。反応混合物の水層を除いた。有機層を水で洗浄し、無水硫酸マグネシウムで乾燥し、濃縮した。得られた残渣のアセトン (2 ml) 溶液に、ヨウ化メチル (118 μ l) を加えた。反応混合物を室温で 18 時間攪

20

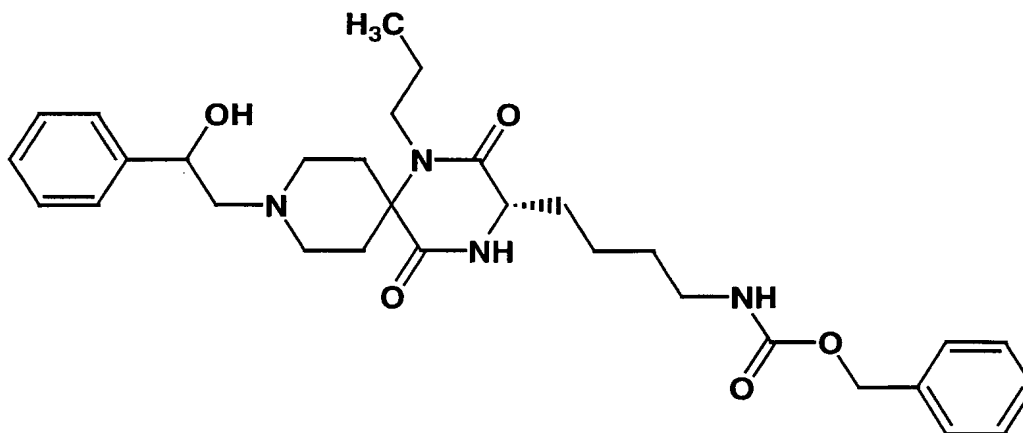
拌した。反応混合物を濃縮した。得られた残渣をジエチルエーテルによって
 固化させ、以下の物性値を有する本発明化合物（58mg）を得た。

TLC : R_f 0.23（酢酸エチル：酢酸：水＝8：1：1）；

NMR (CD₃OD) : δ 7.10 - 6.90 (m, 3 H), 4.60 + 4.49 (s + s, 2 H), 4.29 (s, 4 H),
 5 4.20 - 4.00 (m, 3 H), 3.70 - 3.35 (m, 4 H), 3.11 + 2.99 (s + s, 3 H), 2.80 - 2.30 (m,
 2 H), 2.30 - 2.00 (m, 2 H), 1.90 - 1.10 (m, 15 H), 1.10 - 0.80 (m, 5 H)。

実施例 17

(3S) - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) -
 10 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチル) - 1 - プ
 ロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ[5, 5]ウンデカン



実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) の 2 - プロパノール (0.4 mL) 溶液
 に、スチレンオキシド (10 μ l) を加えた。反応混合物を 4 時間還流した。
 15 反応混合物を室温まで冷却した後、反応混合物を予めメタノール (3 mL)
 で洗浄したイオン交換樹脂 (OASIS MCX、Waters、60 mg)
 に吸着させた。メタノール (2 mL) で洗浄後、10% トリエチルアミン -
 メタノール溶液 (2 mL) で溶出した。溶出液を減圧濃縮し、以下の物性値
 を有する本発明化合物 (13 mg) を得た。

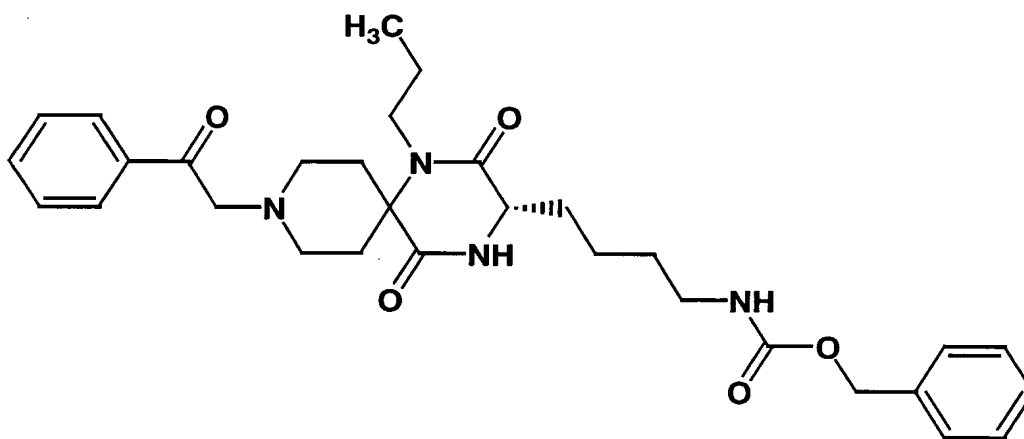
TLC : R_f 0.34 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.20 (m, 10H), 5.06 (s, 2H), 4.03 (m, 1H), 3.40 (m, 2H), 3.12 (m, 2H), 3.10-2.60 (m, 6H), 2.50 (m, 1H), 2.40-2.00 (m, 2H), 2.00-1.70 (m, 4H), 1.70-1.20 (m, 6H), 0.93 (t, J=7.2 Hz, 3H)。

5

実施例 18

(3S)-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-2,5-ジオキソ-9-(2-オキソ-2-フェニルエチル)-1-プロピル-1,4,9-トリアザスピロ[5,5]ウンデカン



10

実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) のジメチルホルムアミド (0.4 ml) 溶液に、トリエチルアミン (6 μ l)、フェナシルブロミド (9 mg) を加えた。反応混合物液を室温にて 24 時間放置した。反応混合物に、酢酸 (0.4 ml) を加えて酸性にした。反応混合物を予めメタノール (6 mL) で洗浄したイオン交換樹脂 (OASIS MCX、Waters、120 mg) に吸着させた。メタノール (2 ml) で洗浄後、10% トリエチルアミン-メタノール溶液 (4 ml) で溶出した。溶出液を減圧濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (12 mg) を得た。

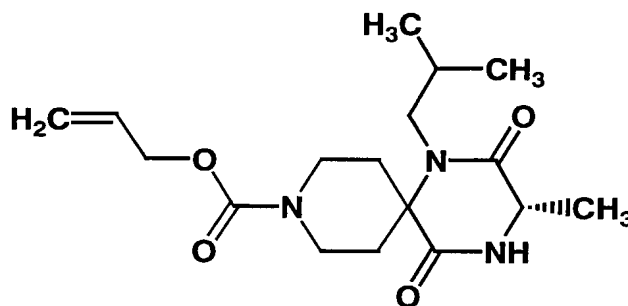
15

TLC : R_f 0.33 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 8.01 (m, 2H), 7.54 (m, 3H), 7.33 (m, 5H), 5.05 (s, 2H), 4.02 (m, 1H), 4.00 (s, 2H), 3.44 (m, 2H), 3.12 (t, J=6.6 Hz, 2H), 2.95 (m, 2H), 2.40-2.10 (m, 2H), 2.00-1.70 (m, 5H), 1.68-1.20 (m, 7H), 0.94 (t, J=7.2 Hz, 3H)。

5 実施例 19

(3S)-1-(2-メチルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-メチル-9-アリルオキシカルボニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



- 10 参考例 8 で製造した樹脂 (6) (300 mg) のテトラヒドロフラン (1.5 ml) とメタノール (1.5 ml) の懸濁液に、室温で N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン (403 mg)、イソブチルアミン (0.22 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-アラニン (381 mg) を加えた。反応混合物を 65℃ で 20 時間攪拌した。反応溶液を室温で冷却し、樹脂を
- 15 ろ取した。得られた樹脂をテトラヒドロフラン (3 ml × 4 回) および塩化メチレン (3 ml × 5 回) で洗浄し、乾燥して、樹脂 (384 mg) を得た。得られた樹脂 (146 mg) の 1.5M 2,6-ルチジン-塩化メチレン (2 ml) 懸濁液に、1M トリフルオロメタンスルホン酸トリメチルシリル-塩化メチレン溶液 (2 ml) を加え、室温で 30 分攪拌した。反応溶液をろ過し、
- 20 塩化メチレン (2 ml × 3 回) で洗浄した。得られた樹脂を再度、1.5M 2,6-ルチジン-塩化メチレン溶液 (2 ml) に懸濁し、1M トリフルオロメ

タンズルホン酸トリメチルシリル-塩化メチレン溶液 (2 ml) を加え、室温で 30 分攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、塩化メチレン (2 ml × 4 回)、メタノール (2 ml × 4 回)、および塩化メチレン (2 ml × 4 回) で洗浄し、乾燥し、樹脂を得た。得られた樹脂を 1.25M 酢酸-トルエン溶液 (2 ml) に懸濁した。反応混合物を 90℃ で 20 時間攪拌した。反応混合物をろ過し、トルエン (2 ml × 3 回) およびメタノール (2 ml × 4 回) で洗浄した。ろ液を濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (19 mg) を得た。

TLC: R_f 0.39 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

10 MS (ESI, Pos., 20 V) : 388 (M + H)⁺ ;

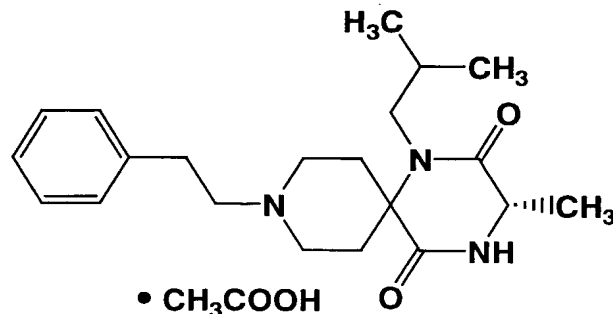
HPLC 条件: F ;

HPLC 保持時間: 3.40 分 ;

NMR (CD₃OD): δ 5.98 (ddt, J = 15.8, 10.4, 5.4 Hz, 1H), 5.30 (m, 1H), 5.21 (m, 1H), 4.59 (m, 2H), 4.20-4.00 (m, 3H), 3.85-3.60 (m, 2H), 3.41 (dd, J = 14.2, 8.0 Hz, 1H), 3.18 (dd, J = 14.2, 7.2 Hz, 1H), 2.10-1.70 (m, 5H), 1.43 (d, J = 6.8 Hz, 3H), 0.89 (t, J = 6.2 Hz, 6H)。

実施例 19 (1)

(3S) - 1 - (2-メチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3-メチル-
20 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウン
デカン・酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200 mg)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (252 mg)、イソブチルアミン (0.123 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-アラニン (235 mg) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (50 mg) を得た。

TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

MS (ESI, Pos., 20 V) : 358 (M + H)⁺ ;

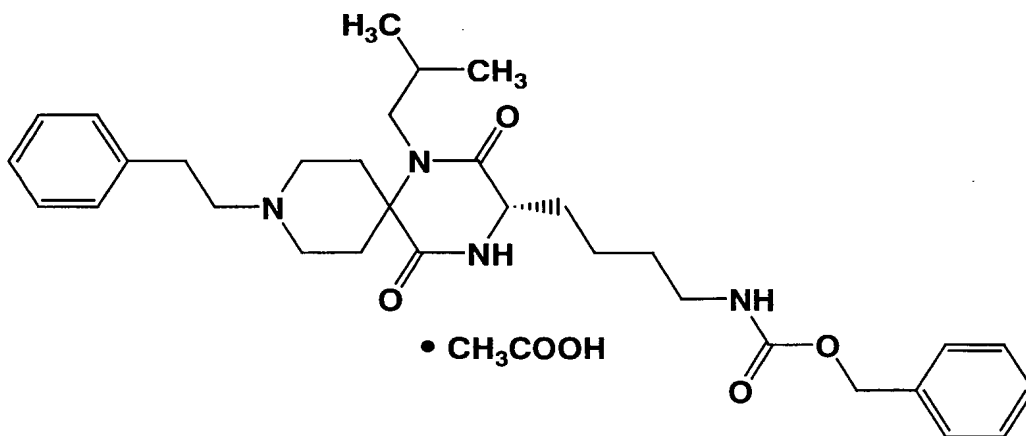
HPLC 条件 : F ;

HPLC 保持時間 : 3.14 分 ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.20 (m, 5 H), 4.15 (q, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.65 (m, 1 H), 3.55 - 3.35 (m, 3 H), 3.25 - 3.05 (m, 3 H), 3.05 - 2.90 (m, 3 H), 2.50 - 2.05 (m, 4 H), 1.98 (s, 3 H), 1.92 (m, 1 H), 1.43 (d, J = 6.8 Hz, 3 H), 0.92 (t, J = 6.4 Hz, 6 H)。

15 実施例 19 (2)

(3S)-1-(2-メチルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200mg)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (252mg)、イソブチルアミン (0.123ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-N'-(ベンジルオキシカルボニル)-L-リジン (472mg) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、

5 以下の物性値を有する本発明化合物（71mg）を得た。

TLC : Rf 0.44 (クロロホルム：メタノール=10：1)；

MS (ESI, Pos., 20 V) : 549 (M + H)⁺ ;

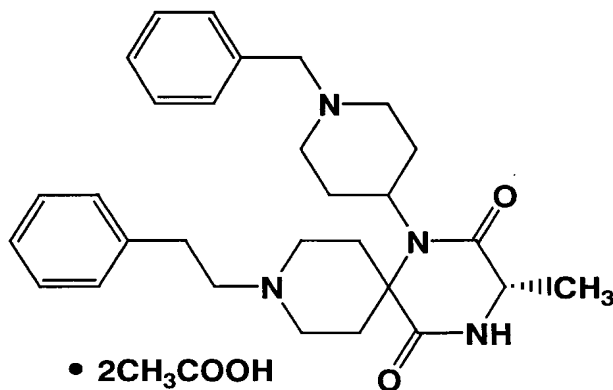
HPLC条件：F；

HPLC 保持時間：3.49 分；

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.20 (m, 10 H), 5.06 (s, 2 H), 4.10 (m, 1 H), 3.67 (m, 1 H), 3.60 - 3.40 (m, 3 H), 3.28 - 3.05 (m, 5 H), 3.05 - 2.90 (m, 3 H), 2.50 - 2.10 (m, 4 H), 1.98 (s, 3 H), 2.05 - 1.70 (m, 3 H), 1.65 - 1.20 (m, 4 H), 0.92 (t, J = 6.2 Hz, 6 H)。

15 实施例 19 (3)

(3S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジオキソ
- 3 - メチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ
[5. 5] ウンデカン・二酢酸塩



20 参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200mg)、N-(2-フェニルエチ

ル) - 4 - ピペリドン (252 mg)、4 - アミノ - 1 - ベンジルピペリジン (0.253 ml) および N - (t - ブチルオキシカルボニル) - L - アラニン (235 mg) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (41 mg) を得た。

5 TLC : R_f 0.10 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

MS (ESI, Pos., 20 V) : 475 (M + H)⁺ ;

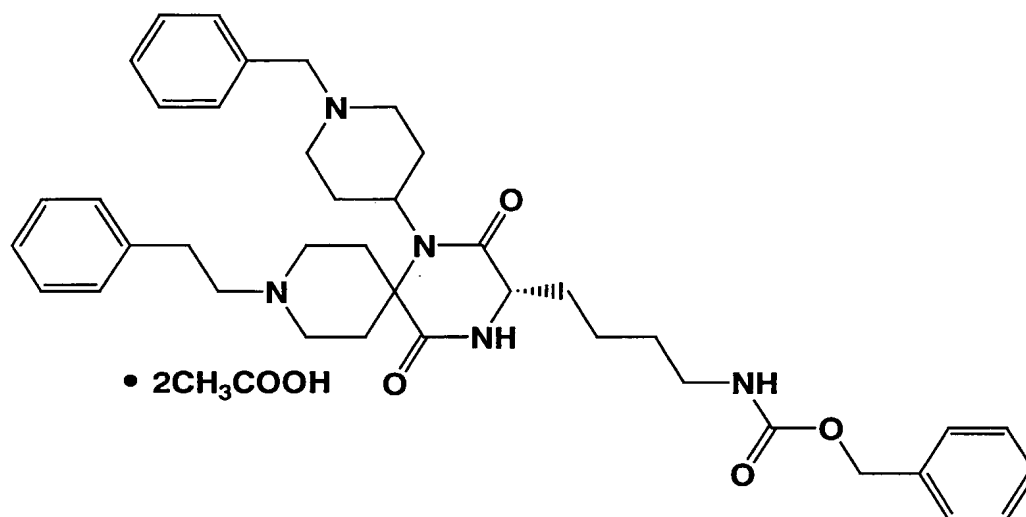
HPLC 条件 : F ;

HPLC 保持時間 : 3.09 分 ;

10 NMR (CD₃OD) : δ 7.47 (m, 5 H), 7.40 - 7.20 (m, 5 H), 4.19 (s, 2 H), 4.00 (q, J = 6.8 Hz, 1 H), 3.80 - 3.53 (m, 4 H), 3.53 - 3.35 (m, 4 H), 3.30 - 3.15 (m, 2 H), 3.15 - 2.90 (m, 3 H), 2.55 - 2.30 (m, 3 H), 2.30 - 2.00 (m, 2 H), 1.98 (s, 6 H), 1.85 - 1.70 (m, 3 H), 1.42 (d, J = 7.0 Hz, 3 H)。

実施例 19 (4)

15 (3S) - 1 - (1 - ベンジルピペリジン - 4 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (N - ベンジルオキシカルボニル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン・二酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200 mg)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (252 mg)、4-アミノ-1-ベンジルピペリジン (0.253 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-N'-(ベンジルオキシカルボニル)-L-リジン (472 mg) を用いて、実施例 19

と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (33 mg) を得た。

TLC: R_f 0.12 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

MS (ESI, Pos., 20 V) : 666 (M + H)⁺ ;

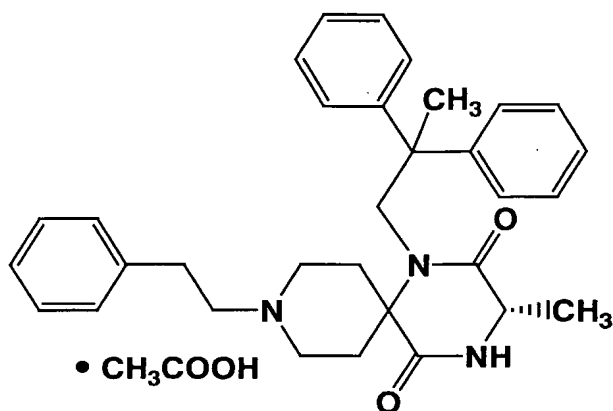
HPLC 条件 : F ;

10 HPLC 保持時間 : 3.36 分 ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.46 (m, 5 H), 7.40 - 7.20 (m, 10 H), 5.03 (s, 2 H), 4.19 (s, 2 H), 3.99 (m, 1 H), 3.80 - 3.40 (m, 6 H), 3.30 - 2.85 (m, 9 H), 2.50 - 2.10 (m, 6 H), 1.98 (s, 6 H), 1.95 - 1.60 (m, 4 H), 1.60 - 1.40 (m, 4 H)。

15 実施例 19 (5)

(3S)-1-(2,2-ジフェニルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-メチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200 mg)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (252 mg)、2,2-ジフェニルプロピルアミン (307 mg) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-L-アラニン (235 mg) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (22 mg) を得た。

TLC: R_f 0.42 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

MS (ESI, Pos., 20 V) : 496 (M + H)⁺ ;

HPLC 条件 : F ;

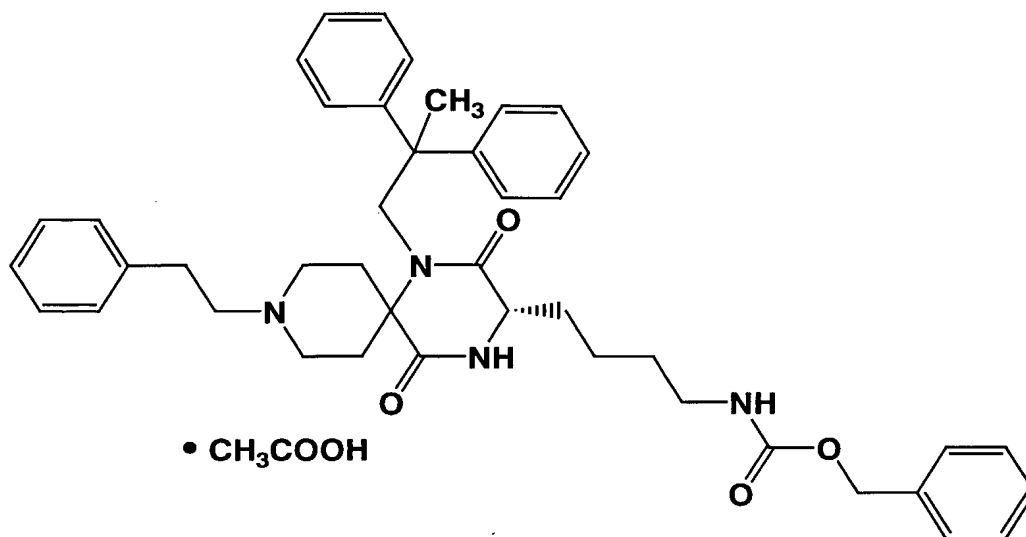
10 HPLC 保持時間 : 3.58 分 ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.10 (m, 15 H), 4.79 (m, 1 H), 4.16 (m, 1 H), 3.93 (m, 1 H), 3.71 (s, 2 H), 3.23 (m, 1 H), 3.10 - 2.80 (m, 5 H), 1.98 (s, 3 H), 1.95 - 1.82 (m, 2 H), 1.70 - 1.15 (m, 1 H), 1.58 (s, 3 H), 1.49 (d, J = 6.8 Hz, 3 H), 0.70 (m, 1 H)。

15

実施例 19 (6)

(3S)-1-(2,2-ジフェニルプロピル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルオキシカルボニル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (200 mg)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (252 mg)、2,2-ジフェニルプロピルアミン (307 mg) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-N'-(ベンジルオキシカルボニル)-L-リジン (472 mg) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (18 mg) を得た。

MS (ESI, Pos., 20 V) : 687 (M + H)⁺ ;

HPLC 条件 : F ;

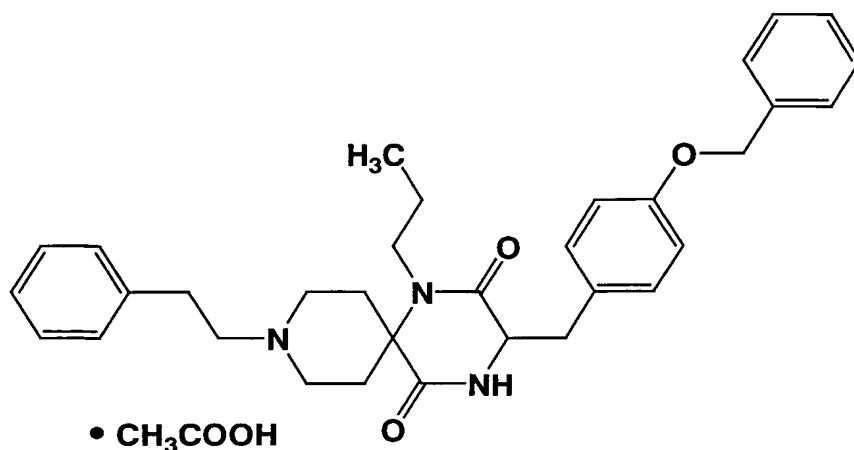
HPLC 保持時間 : 3.80 分 ;

10 TLC : R_f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40 - 7.00 (m, 20 H), 5.06 (s, 2 H), 4.16 (m, 1 H), 3.93 (m, 1 H), 3.70 (s, 2 H), 3.55 (m, 1 H), 3.30 - 3.10 (m, 2 H), 3.10 - 2.80 (m, 6 H), 1.98 (s, 3 H), 1.95 - 1.85 (m, 2 H), 1.80 (s, 3 H), 1.70 - 1.30 (m, 8 H)。

15 実施例 19 (7)

(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



参考例 8 で製造した樹脂 (6) (0.5 g)、N-(2-フェニルエチル)-4-ピペリドン (0.32 g)、n-プロピルアミン (0.13 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル)-O-ベンジル-L-チロシン (0.58 g) を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (68 mg) を得た。

TLC : R_f 0.51 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.50-7.10 (m, 10H), 7.06 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 6.92 (d, J = 8.8 Hz, 2H), 5.07 (s, 2H), 4.31 (m, 1H), 3.68 (m, 1H), 3.40 (m, 1H), 3.28-3.13 (m, 4H), 3.13-2.80 (m, 6H), 2.30-2.00 (m, 2H), 1.80-1.35 (m, 4H), 0.91 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 19 (H1-1) ~ 19 (H13-62)

参考例 8 で製造した樹脂 (6)、相当する 4-ピペリドン誘導体、相当するアミン誘導体および相当するアミノ酸誘導体を用いて、実施例 19 と同様の操作をし、以下の表 1A-1 ~ 13A-9 に化合物名を示し、表 1B-1 ~ 13B-7 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 1C-1 ~ 13C-3 に示した。

本明細書の表中、

20 X₁ は、R¹ の結合部位を表わし、

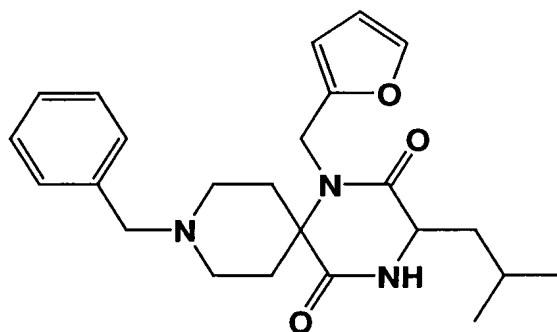
X_2 は、 R^2 の結合部位を表わし、

X_3 は、 R^3 の結合部位を表わし、

X_4 は、 R^4 の結合部位を表わし、

X_5 は、 R^5 の結合部位を表わす。

- 5 例えば、実施例 19 (H1-1) の構造式は、以下のように表わされる。



さらに、本明細書の表中の高速液体クロマトグラフィー (HPLC) の測定条件を以下に示した。

条件A

- 10 使用したカラム：YMC-Pack FL-ODS、 50×4.6 mm I.D.、S-5 μ m、120A

使用した流速：1 mL/min

使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：メタノール

- 15 測定開始後2分間はA液とB液の混合比を90/10に固定した。その後20分間でA液とB液の混合比を20/80に直線的に変えた。その後5分間A液とB液の混合比を20/80に固定した。その後1分間でA液とB液の混合比を90/10に直線的に変えた。

条件B

- 20 使用したカラム：YMC-Pack FL-ODS、 50×4.6 mm I.D.、S-5 μ m、120A

使用した流速：1 mL/min

使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：メタノール

- 測定開始後2分間はA液とB液の混合比を80/20に固定した。その後
5 20分間でA液とB液の混合比を20/80に直線的に変えた。その後5分
間A液とB液の混合比を20/80に固定した。その後1分間でA液とB液
の混合比を80/20に直線的に変えた。

条件C

使用したカラム：YMC-Pack FL-ODS、50×4.6mmI.D.、S-5 μ m、120A

- 10 使用した流速：1 mL/min

使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：メタノール

- 測定開始後1分間はA液とB液の混合比を90/10に固定した。その後
15 16分間でA液とB液の混合比を10/90に直線的に変えた。その後1分
間A液とB液の混合比を10/90に固定した。その後1分間でA液とB液
の混合比を90/10に直線的に変えた。

条件D

使用したカラム：YMC-Pack FL-ODS、50×4.6mmI.D.、S-5 μ m、120A

- 20 使用した流速：1 mL/min

使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：メタノール

- 測定開始時A液とB液の混合比を90/10にした。その後16分間でA
25 液とB液の混合比を10/90に直線的に変えた。その後0.5分間A液とB液
の混合比を10/90に固定した。その後0.5分間でA液とB液の混合比を9

0 / 1 0 に直線的に変えた。

条件E

使用したカラム：YMC-Pack FL-ODS、50×4.6mm I.D.、S-5 μ m、120A

使用した流速：3 mL / m i n

5 使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：メタノール

測定開始時A液とB液の混合比を9 0 / 1 0にした。その後5分間でA液とB液の混合比を1 0 / 9 0に直線的に変えた。その後0.5分間A液とB液の混合比を1 0 / 9 0に固定した。その後0.1分間でA液とB液の混合比を9 0 / 1 0に直線的に変えた。

条件F

使用したカラム：Xterra™ MS C₁₈ 5 μ m、4.6 x 50mm I.D.

使用した流速：3 mL / m i n

15 使用した溶媒

A液：0.1%トリフルオロ酢酸水溶液

B液：0.1%トリフルオロ酢酸－アセトニトリル溶液

測定開始後 0.5 分間はA液とB液の混合比を9 5 / 5に固定した。その後2.5分間でA液とB液の混合比を0 / 1 0 0に直線的に変えた。その後0.5分間A液とB液の混合比を0 / 1 0 0に固定した。その後0.01分間でA液とB液の混合比を9 5 / 5に直線的に変えた。

表 1A-1

実施例番号	化合物名
19(H1-1)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-2)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-3)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-4)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-5)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-6)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-7)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-8)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-9)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 1A-2

実施例番号	化合物名
19(H1-10)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-11)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-12)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-13)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-14)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-15)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-16)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-17)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-18)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 1A-3

実施例番号	化合物名
19(H1-19)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-20)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-21)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-22)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-23)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-24)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-25)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-26)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-27)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 1A-4

実施例番号	化合物名
19(H1-28)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-29)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-30)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-31)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-32)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-33)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-34)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-35)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-36)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-37)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 1A-5

実施例番号	化合物名
19(H1-38)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-39)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-40)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-41)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-42)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-43)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-44)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-45)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19(H1-46)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 1A-6

実施例番号	化合物名
19(H1-47)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-48)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-49)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-50)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-51)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-52)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-53)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19(H1-54)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 1A-7

実施例番号	化合物名
19 (H1-55)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-1

実施例番号	化合物名
19 (H2-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-3)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-4)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-5)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-6)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-7)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-2

実施例番号	化合物名
19 (H2-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-10)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (2 - フェニルエ チル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-11)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-12)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブ チル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリア ザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-13)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリア ザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-14)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニル エチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ ン
19 (H2-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - フェニルメチル-9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-3

実施例番号	化合物名
19 (H2-17)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-18)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-19)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-20)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-21)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-22)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-23)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-24)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H2-25)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 2A-4

実施例番号	化合物名
19 (H2-26)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-27)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-28)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-29)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-30)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-31)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-32)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-33)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H2-34)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 2A-5

実施例番号	化合物名
19 (H2-35)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-36)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-37)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-38)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-39)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-40)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-41)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-42)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-6

実施例番号	化合物名
19 (H2-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-48)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-49)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-51)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(2-フェニルエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-7

実施例番号	化合物名
19 (H2-52)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-53)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-54)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-55)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-56)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-58)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-59)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 2A-8

実施例番号	化合物名
19 (H2-60)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H2-61)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-1

実施例番号	化合物名
19 (H3-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-3)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-4)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-5)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-6)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-7)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プチル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-2

実施例番号	化合物名
19 (H3-10)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-フェニルメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-11)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-12)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-13)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-14)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-17)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-フェニルメチル-9 - (3-フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-3

実施例番号	化合物名
19 (H3-18)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-19)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-20)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-21)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-22)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-23)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-24)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-3 - フェニルメチル-9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-25)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-4

実施例番号	化合物名
19 (H3-26)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジロキシメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-27)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジロキシカルボニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-28)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジロキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-29)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-30)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-31)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-32)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-33)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジロキシメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H3-34)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジロキシカルボニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 3A-5

実施例番号	化合物名
19 (H3-35)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-36)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-37)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-38)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-39)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-40)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-41)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-42)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-43)	1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-6

実施例番号	化合物名
19 (H3-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-51)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-52)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-7

実施例番号	化合物名
19 (H3-53)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-54)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-55)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-56)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-58)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-59)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-60)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 3A-8

実施例番号	化合物名
19 (H3-61)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-62)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H3-63)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 4A-1

実施例番号	化合物名
19 (H4-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-3)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-4)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-5)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-6)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-7)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 4A-2

実施例番号	化合物名
19 (H4-10)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-11)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-12)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-13)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-14)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-17)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 4A-3

実施例番号	化合物名
19 (H4-18)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-19)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-20)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-21)	1-(2-(インドール-3-イル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-22)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-23)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-24)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-25)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-26)	1-ベンジル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 4A-4

実施例番号	化合物名
19 (H4-27)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-28)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-29)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-30)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-31)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-32)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-33)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-34)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-35)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 4A-5

実施例番号	化合物名
19 (H4-36)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-37)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-38)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-39)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-40)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-41)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-42)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-43)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-44)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 4A-6

実施例番号	化合物名
19 (H4-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-51)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-52)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H4-53)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(4-フェニルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 4A-7

実施例番号	化合物名
19 (H4-54)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-55)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-56)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-58)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-59)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-60)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-61)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 4A-8

実施例番号	化合物名
19 (H4-62)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H4-63)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 5A-1

実施例番号	化合物名
19 (H5-1)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-2)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-3)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-4)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-5)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジロキシメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-6)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジロキシカルボニルメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-7)	1-(フラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジロキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-8)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-9)	1-(テトラヒドロフラン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 5A-2

実施例番号	化合物名
19 (H5-10)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-11)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-12)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-13)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-14)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-17)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-18)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9-フェニル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 5A-3

実施例番号	化合物名
19 (H5-19)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-20)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-21)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-22)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-23)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-24)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-25)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-26)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-27)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - フェニル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 5A-4

実施例番号	化合物名
19 (H5-28)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-29)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-30)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-31)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-32)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-33)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-34)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-35)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-36)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 5A-5

実施例番号	化合物名
19 (H5-37)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-38)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-39)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-40)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-41)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-42)	1-(2-フェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H5-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 5A-6

実施例番号	化合物名
19 (H5-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-51)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-52)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-53)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H5-54)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 5A-7

実施例番号	化合物名
19 (H5-55)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-56)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-57)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-58)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-59)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-60)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-61)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H5-62)	1-(1-ベンジルピロリジン-3-イル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-フェニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 6A-1

実施例番号	化合物名
19 (H6-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-3)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-4)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-5)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - フェニルメチル-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-6)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-7)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 6A-2

実施例番号	化合物名
19 (H6-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-10)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-11)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-12)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-13)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-14)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 6A-3

実施例番号	化合物名
19 (H6-17)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-18)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-19)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-20)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-21)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-22)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-23)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-24)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-25)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 6A-4

実施例番号	化合物名
19 (H6-26)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-27)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-28)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-29)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-30)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-31)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-32)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-33)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 6A-5

実施例番号	化合物名
19 (H6-34)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-35)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-36)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-37)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-38)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-39)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-40)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-41)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H6-42)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 6A-6

実施例番号	化合物名
19 (H6-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-45)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-46)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-47)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-48)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-49)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H6-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(5-フェニルペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 6A-7

実施例番号	化合物名
19 (H6-51)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-52)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-53)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-54)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-55)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-56)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H6-58)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-1

実施例番号	化合物名
19 (H7-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-3)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジル-9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-4)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-5)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-6)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-7)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - フェニルメチル-9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-2

実施例番号	化合物名
19 (H7-10)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-11)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-12)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-13)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-14)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-17)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-3

実施例番号	化合物名
19 (H7-18)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-19)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-20)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-21)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-22)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-23)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-24)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-25)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-26)	1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-4

実施例番号	化合物名
19 (H7-27)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-28)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-29)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-30)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-31)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-32)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-33)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-34)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-5

実施例番号	化合物名
19 (H7-35)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-36)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-37)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-38)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-39)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-40)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-41)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-42)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H7-43)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 7A-6

実施例番号	化合物名
19 (H7-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-47)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-48)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-49)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-50)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
19 (H7-51)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-(6-フェニルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 7A-7

実施例番号	化合物名
19 (H7-52)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-53)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-54)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-55)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-56)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-58)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H7-59)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 7A-8

実施例番号	化合物名
19 (H7-60)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-1

実施例番号	化合物名
19 (H8-1)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジル-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-2)	1 - (フラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-3)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-4)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-5)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - フェニルメチル-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-6)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-7)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-8)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-9)	1 - (テトラヒドロフラン-2-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-2

実施例番号	化合物名
19 (H8-10)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-9-メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-11)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-12)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - フェニルメチル-9 - メチル-1, 4, 9 - ト リアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-13)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (インドール-3-イルメチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-14)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - ベンジルオキシメチル-9 - メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-15)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - ベンジルオキシカルボニルメチル-9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-16)	1 - (2 - (インドール-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジ オキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プ チル) - 9 - メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-17)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-9 - メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-18)	1 - ベンジル-2, 5 - ジオキソ-3 - (2 - メチルプロピ ル) - 9 - メチル-1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-3

実施例番号	化合物名
19 (H8-19)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-20)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-21)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-22)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-23)	1-ベンジル-2, 5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-24)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-25)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-26)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-27)	1-(2, 2-ジフェニルエチル)-2, 5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-メチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-4

実施例番号	化合物名
19 (H8-28)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-29)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-30)	1 - (2, 2 - ジフェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-31)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-32)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-33)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-34)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-35)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-36)	1 - (2 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-5

実施例番号	化合物名
19 (H8-37)	1-(2-フェニルエチル)-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-38)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-39)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-40)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-フェニルメチル-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-41)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(インドール-3-イルメチル)-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-42)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシメチル-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-43)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-ベンジルオキシカルボニルメチル-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-44)	1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
19 (H8-45)	1-(2-(t-ブチルオキシカルボニル)エチル)-2,5-ジオキソ-9-メチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 8A-6

実施例番号	化合物名
19 (H8-46)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-47)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-48)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-49)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-50)	1 - (2 - (t - ブチルオキシカルボニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-51)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-52)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-53)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - フェニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-54)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (インドール - 3 - イルメチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 8A-7

実施例番号	化合物名
19 (H8-55)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-56)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - ベンジルオキシカルボニルメチル - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H8-57)	1 - (1 - ベンジルピロリジン - 3 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - メチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-1

実施例番号	化合物名
19 (H9-1)	(3 S) - 1 - シクロプロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-2)	(3 S) - 1 - シクロブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-3)	(3 S) - 1 - ((1 S, 2 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルビシクロ [3. 1. 1] ヘプタン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-4)	(3 S) - 1 - シクロペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-5)	(3 S) - 1 - シクロヘキシル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-6)	(3 S) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-7)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-2

実施例番号	化合物名
19 (H9-8)	(3 S) - 1 - ((1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-9)	(3 S) - 1 - (インダン - 5 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-10)	(3 S) - 1 - シクロヘプチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-11)	(3 S) - 1 - (チオフェン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-12)	(3 S) - 1 - (2 - (モルホリン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-13)	(3 S) - 1 - (3 - (モルホリン - 4 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-14)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-3

実施例番号	化合物名
19 (H9-15)	(3 S) - 1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-16)	(3 S) - 1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-17)	(3 S) - 1 - (1 - (エトキシカルボニル) ピペリジン-4-イル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-18)	(3 S) - 1 - (2 - (ピペリジン-1-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-19)	(3 S) - 1 - (1-フェニルエチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-20)	(3 S) - 1 - (1-メチルエチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-21)	(3 S) - 1 - (1, 3-ジメチルブチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-4

実施例番号	化合物名
19 (H9-22)	(3 S) - 1 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-23)	(3 S) - 1 - (1 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-24)	(3 S) - 1 - (1 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-25)	(3 S) - 1 - ((2 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-26)	(3 S) - 1 - ((2 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-27)	(3 S) - 1 - ((3 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-28)	(3 S) - 1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-5

実施例番号	化合物名
19 (H9-29)	(3 S) - 1 - ((4-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-30)	(3 S) - 1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-31)	(3 S) - 1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-32)	(3 S) - 1 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-33)	(3 S) - 1 - (2-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-34)	(3 S) - 1 - (2-メチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-35)	(3 S) - 1 - (2-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-6

実施例番号	化合物名
19 (H9-36)	(3 S) - 1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-37)	(3 S) - 1 - (2 - (N, N - ジメチルアミノ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-38)	(3 S) - 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-39)	(3 S) - 1 - (2 - プロピニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-40)	(3 S) - 1 - (2 - プロペニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-41)	(3 S) - 1 - (3 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-42)	(3 S) - 1 - (3 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-7

実施例番号	化合物名
19 (H9-43)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-44)	(3S) - 1 - (3 - (N, N - ジメチルアミノ) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-45)	(3S) - 1 - (3 - エトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-46)	(3S) - 1 - (3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-47)	(3S) - 1 - (4 - フェニルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-48)	(3S) - 1 - ペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-49)	(3S) - 1 - (3 - (イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-8

実施例番号	化合物名
19 (H9-50)	(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-51)	(3S) - 1 - (2 - (1 - シクロヘキセニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-52)	(3S) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-53)	(3S) - 1 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-54)	(3S) - 1 - (3 - メトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-55)	(3S) - 1 - (2 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-56)	(3S) - 1 - ((3 - クロロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 9A-9

実施例番号	化合物名
19 (H9-57)	(3 S) - 1 - (3 - メチルチオプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-58)	(3 S) - 1 - (2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-59)	(3 S) - 1 - (2 - (1, 1 - ジメチルエチルチオ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-60)	(3 S) - 1 - ((t - ブトキシカルボニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-61)	(3 S) - 1 - ((5 - メチルフラン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H9-62)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 3 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-1

実施例番号	化合物名
19 (H10-1)	(3 S) - 1 - シクロプロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-2)	(3 S) - 1 - シクロブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-3)	(3 S) - 1 - ((1 S, 2 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルピシクロ [3. 1. 1] ヘプタン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-4)	(3 S) - 1 - シクロペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-5)	(3 S) - 1 - シクロヘキシル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-6)	(3 S) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-7)	(3 S) - 1 - シクロオクチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-2

実施例番号	化合物名
19 (H10-8)	(3S) - 1 - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-9)	(3S) - 1 - ((1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-10)	(3S) - 1 - (インダン - 5 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-11)	(3S) - 1 - シクロヘプチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-12)	(3S) - 1 - (チオフェン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-13)	(3S) - 1 - (2 - (モルホリン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-14)	(3S) - 1 - (3 - (モルホリン - 4 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-3

実施例番号	化合物名
19 (H10-15)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン-2-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-16)	(3 S) - 1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-17)	(3 S) - 1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-18)	(3 S) - 1 - (1 - (エトキシカルボニル) ピペリジン-4-イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-19)	(3 S) - 1 - (2 - (ピペリジン-1-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-20)	(3 S) - 1 - フェニル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-21)	(3 S) - 1 - (1 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-4

実施例番号	化合物名
19 (H10-22)	(3 S) - 1 - (1 - メチルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-23)	(3 S) - 1 - (1, 3 - ジメチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-24)	(3 S) - 1 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-25)	(3 S) - 1 - (1 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-26)	(3 S) - 1 - (1 - エチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-27)	(3 S) - 1 - (1 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-28)	(3 S) - 1 - ((2 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-5

実施例番号	化合物名
19 (H10-29)	(3 S) - 1 - ((2 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-30)	(3 S) - 1 - ((3 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-31)	(3 S) - 1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-32)	(3 S) - 1 - ((4 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-33)	(3 S) - 1 - ((4 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-34)	(3 S) - 1 - ((4 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-35)	(3 S) - 1 - (2, 2 - ジメチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-6

実施例番号	化合物名
19 (H10-36)	(3S) - 1 - (2-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-37)	(3S) - 1 - (2-メチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-38)	(3S) - 1 - (2-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-39)	(3S) - 1 - ベンジル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-40)	(3S) - 1 - (2 - (N, N-ジメチルアミノ) エチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-41)	(3S) - 1 - (2-メトキシエチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-42)	(3S) - 1 - (2-プロピニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-7

実施例番号	化合物名
19 (H10-43)	(3S) - 1 - (2-プロペニル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-44)	(3S) - 1 - (3-ヒドロキシプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-45)	(3S) - 1 - (3-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-46)	(3S) - 1 - プロピル - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-47)	(3S) - 1 - (3 - (N, N-ジメチルアミノ) プロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-48)	(3S) - 1 - (3-エトキシプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-49)	(3S) - 1 - (3-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2-フェニルエチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-8

実施例番号	化合物名
19 (H10-50)	(3 S) - 1 - (4 - フェニルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピ ロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-51)	(3 S) - 1 - ペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベン ジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェ ニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H10-52)	(3 S) - 1 - (3 - (イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニ ルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-53)	(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベン ジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェ ニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H10-54)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - シクロヘキセニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニル アミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-55)	(3 S) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2, 5 - ジオキ ソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピ ル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザ スピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-56)	(3 S) - 1 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベン ジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェ ニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン

表 10A-9

実施例番号	化合物名
19 (H10-57)	(3 S) - 1 - (3 - メトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-58)	(3 S) - 1 - (2 - (N - エチル - N - (3 - メチルフェニル) アミノ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-59)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-60)	(3 S) - 1 - ((3 - クロロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-61)	(3 S) - 1 - (3 - メチルチオプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-62)	(3 S) - 1 - (2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-63)	(3 S) - 1 - (2 - (1, 1 - ジメチルエチルチオ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 10A-10

実施例番号	化合物名
19 (H10-64)	(3 S) - 1 - ((t - ブトキシカルボニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-65)	(3 S) - 1 - ((2 S) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-66)	(3 S) - 1 - ((5 - メチルフラン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-67)	(3 S) - 1 - ((1 R) - 1 - (4 - メチルフェニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H10-68)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 3 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (3 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) プロピル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-1

実施例番号	化合物名
19 (H11-1)	(3 S) - 1 - シクロプロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-2)	(3 S) - 1 - シクロブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-3)	(3 S) - 1 - ((1 S, 2 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルビシクロ [3. 1. 1] ヘプタン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-4)	(3 S) - 1 - シクロペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-5)	(3 S) - 1 - シクロヘキシル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-6)	(3 S) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-7)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-8)	(3 S) - 1 - ((1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-2

実施例番号	化合物名
19 (H11-9)	(3 S) - 1 - (インダン-5-イル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-10)	(3 S) - 1 - シクロヘプチル - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-11)	(3 S) - 1 - (チオフェン-2-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-12)	(3 S) - 1 - (2 - (モルホリン-4-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-13)	(3 S) - 1 - (3 - (モルホリン-4-イル) プロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-14)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン-2-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-15)	(3 S) - 1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-3

実施例番号	化合物名
19 (H11-16)	(3 S) - 1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-17)	(3 S) - 1 - (1 - (エトキシカルボニル) ピペリジン-4-イル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-18)	(3 S) - 1 - (2 - (ピペリジン-1-イル) エチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-19)	(3 S) - 1 - (1-フェニルエチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-20)	(3 S) - 1 - (1-メチルエチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-21)	(3 S) - 1 - ((2-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-22)	(3 S) - 1 - ((2-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9 - (4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-4

実施例番号	化合物名
19 (H11-23)	(3 S) - 1 - ((3-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-24)	(3 S) - 1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-25)	(3 S) - 1 - ((4-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-26)	(3 S) - 1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-27)	(3 S) - 1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-28)	(3 S) - 1 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-29)	(3 S) - 1 - (2-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル) - 9-(4-フェニルブチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-5

実施例番号	化合物名
19 (H11-30)	(3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-31)	(3 S) - 1 - (2 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-32)	(3 S) - 1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メ チルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-33)	(3 S) - 1 - (2 - (N, N - ジメチルアミノ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-34)	(3 S) - 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-35)	(3 S) - 1 - (2 - プロピニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-36)	(3 S) - 1 - (2 - プロペニル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-37)	(3 S) - 1 - (3 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオ キソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブ チル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-6

実施例番号	化合物名
19 (H11-38)	(3 S) - 1 - (3 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-39)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-40)	(3 S) - 1 - (3 - (N, N - ジメチルアミノ) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-41)	(3 S) - 1 - (3 - エトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-42)	(3 S) - 1 - (3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-43)	(3 S) - 1 - (4 - フェニルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-44)	(3 S) - 1 - ペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-45)	(3 S) - 1 - (3 - (イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-7

実施例番号	化合物名
19 (H11-46)	(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-47)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - シクロヘキセニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-48)	(3 S) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-49)	(3 S) - 1 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-50)	(3 S) - 1 - (3 - メトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-51)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-52)	(3 S) - 1 - ((3 - クロロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-53)	(3 S) - 1 - (3 - メチルチオプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 11A-8

実施例番号	化合物名
19 (H11-54)	(3 S) - 1 - (2 - (チオフエン-2-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-55)	(3 S) - 1 - (2 - (1, 1 - ジメチルエチルチオ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-56)	(3 S) - 1 - ((t - ブトキシカルボニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-57)	(3 S) - 1 - ((5 - メチルフラン-2-イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H11-58)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン-3-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (4 - フェニルブチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-1

実施例番号	化合物名
19 (H12-1)	(3 S) - 1 - シクロプロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-2)	(3 S) - 1 - シクロブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-3)	(3 S) - 1 - ((1 S, 2 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルビシクロ [3. 1. 1] ヘプタン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-4)	(3 S) - 1 - シクロペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-5)	(3 S) - 1 - シクロヘキシル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-6)	(3 S) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-7)	(3 S) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-8)	(3 S) - 1 - シクロオクチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-2

実施例番号	化合物名
19 (H12-9)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-10)	(3 S) - 1 - ((1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-11)	(3 S) - 1 - (インダン - 5 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-12)	(3 S) - 1 - シクロヘプチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-13)	(3 S) - 1 - (チオフェン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-14)	(3 S) - 1 - (2 - (モルホリン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-15)	(3 S) - 1 - (3 - (モルホリン - 4 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-3

実施例番号	化合物名
19 (H12-16)	(3S) - 1 - (2 - (ピリジン-2-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-17)	(3S) - 1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-18)	(3S) - 1 - (ピリジン-4-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-19)	(3S) - 1 - (2 - (ピペリジン-1-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-20)	(3S) - 1 - フェニル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-21)	(3S) - 1 - (1 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-22)	(3S) - 1 - (1 - メチルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-4

実施例番号	化合物名
19 (H12-23)	(3 S) - 1 - (1, 3 - ジメチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-24)	(3 S) - 1 - (1 - メチル - 3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-25)	(3 S) - 1 - (1 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-26)	(3 S) - 1 - (1 - エチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-27)	(3 S) - 1 - (1 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-28)	(3 S) - 1 - ((2 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-29)	(3 S) - 1 - ((2 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-5

実施例番号	化合物名
19 (H12-30)	(3 S) - 1 - ((3-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-31)	(3 S) - 1 - ((3-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-32)	(3 S) - 1 - ((4-フルオロフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-33)	(3 S) - 1 - ((4-メトキシフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-34)	(3 S) - 1 - ((4-メチルフェニル) メチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-35)	(3 S) - 1 - (2, 2-ジメチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-36)	(3 S) - 1 - (2-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-6

実施例番号	化合物名
19 (H12-37)	(3S) - 1 - (2-メチルプロピル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチ ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-38)	(3S) - 1 - (2-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-39)	(3S) - 1 - ベンジル - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メ チルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-40)	(3S) - 1 - (2 - (N, N-ジメチルアミノ) エチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5 -フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-41)	(3S) - 1 - (2-メトキシエチル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチ ル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-42)	(3S) - 1 - (2-プロピニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-43)	(3S) - 1 - (2-プロペニル) - 2, 5-ジオキソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-44)	(3S) - 1 - (3-ヒドロキシプロピル) - 2, 5-ジオ キソ - 3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (5-フェニルペ ンチル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカ ン

表 12A-7

実施例番号	化合物名
19 (H12-45)	(3 S) - 1 - (3 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-46)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-47)	(3 S) - 1 - (3 - (N, N - ジメチルアミノ) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-48)	(3 S) - 1 - (3 - エトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-49)	(3 S) - 1 - (3 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-50)	(3 S) - 1 - (4 - フェニルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-51)	(3 S) - 1 - ペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-52)	(3 S) - 1 - (3 - (イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-8

実施例番号	化合物名
19 (H12-53)	(3S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-54)	(3S) - 1 - (2 - (1 - シクロヘキセニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-55)	(3S) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-56)	(3S) - 1 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-57)	(3S) - 1 - (1 - プロピルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-58)	(3S) - 1 - (3 - メトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-59)	(3S) - 1 - (2 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-60)	(3S) - 1 - ((3 - クロロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-9

実施例番号	化合物名
19 (H12-61)	(3 S) - 1 - (3 - メチルチオプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-62)	(3 S) - 1 - (2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-63)	(3 S) - 1 - (2 - (1, 1 - ジメチルエチルチオ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-64)	(3 S) - 1 - ((t - ブトキシカルボニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-65)	(3 S) - 1 - ((2 R) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-66)	(3 S) - 1 - ((2 S) - 2 - ヒドロキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-67)	(3 S) - 1 - ((5 - メチルフラン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 12A-10

実施例番号	化合物名
19 (H12-68)	(3 S) - 1 - ((1 R) - 1 - (4 - メチルフェニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H12-69)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 3 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (5 - フェニルペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-1

実施例番号	化合物名
19 (H13-1)	(3 S) - 1 - シクロプロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-2)	(3 S) - 1 - シクロブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-3)	(3 S) - 1 - ((1 S, 2 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルビシクロ [3. 1. 1] ヘプタン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-4)	(3 S) - 1 - シクロペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-5)	(3 S) - 1 - シクロヘキシル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-6)	(3 S) - 1 - (シクロヘキシルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-7)	(3 S) - 1 - (1, 2, 3, 4 - テトラヒドロナフチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-8)	(3 S) - 1 - シクロオクチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-2

実施例番号	化合物名
19 (H13-9)	(3S) - 1 - (2 - (1 - メチルピロリジン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-10)	(3S) - 1 - ((1 - エチルピロリジン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-11)	(3S) - 1 - (インダン - 5 - イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-12)	(3S) - 1 - シクロヘプチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-13)	(3S) - 1 - (チオフェン - 2 - イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-14)	(3S) - 1 - (2 - (モルホリン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-15)	(3S) - 1 - (3 - (モルホリン - 4 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-3

実施例番号	化合物名
19 (H13-16)	(3S) - 1 - (2 - (ピリジン-2-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-17)	(3S) - 1 - (ピリジン-3-イルメチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-18)	(3S) - 1 - (1 - (エトキシカルボニル) ピペリジン-4-イル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-19)	(3S) - 1 - (2 - (ピペリジン-1-イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-20)	(3S) - 1 - (1 - フェニルエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-21)	(3S) - 1 - (1, 2 - ジメチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-22)	(3S) - 1 - (1, 3 - ジメチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-4

実施例番号	化合物名
19 (H13-23)	(3 S) - 1 - (1 - エチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシ ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-24)	(3 S) - 1 - ((2 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H13-25)	(3 S) - 1 - ((2 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H13-26)	(3 S) - 1 - ((3 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H13-27)	(3 S) - 1 - ((3 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H13-28)	(3 S) - 1 - ((4 - フルオロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン
19 (H13-29)	(3 S) - 1 - ((4 - メトキシフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェ ニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウ ンデカン

表 13A-5

実施例番号	化合物名
19 (H13-30)	(3 S) - 1 - ((4 - メチルフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-31)	(3 S) - 1 - (2, 2 - ジメチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-32)	(3 S) - 1 - (2 - フェニルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-33)	(3 S) - 1 - (2 - メチルプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-34)	(3 S) - 1 - (2 - メチルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-35)	(3 S) - 1 - ベンジル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-36)	(3 S) - 1 - (2 - (N, N - ジメチルアミノ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-37)	(3 S) - 1 - (2 - メトキシエチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-6

実施例番号	化合物名
19 (H13-38)	(3S) - 1 - (2-プロピニル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-39)	(3S) - 1 - (2-プロペニル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-40)	(3S) - 1 - (3-ヒドロキシプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-41)	(3S) - 1 - (3-メチルブチル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-42)	(3S) - 1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-43)	(3S) - 1 - (3-(N, N-ジメチルアミノ)プロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-44)	(3S) - 1 - (3-エトキシプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-45)	(3S) - 1 - (3-フェニルプロピル) - 2, 5-ジオキソ-3 - (2-メチルプロピル) - 9 - (6-フェニルヘキシル) - 1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-7

実施例番号	化合物名
19 (H13-46)	(3 S) - 1 - (4 - フェニルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシ ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-47)	(3 S) - 1 - ペンチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メ チルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-48)	(3 S) - 1 - (3 - (イミダゾール - 1 - イル) プロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-49)	(3 S) - 1 - ブチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチ ルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-50)	(3 S) - 1 - (2 - (1 - シクロヘキセニル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-51)	(3 S) - 1 - (シクロプロピルメチル) - 2, 5 - ジオキ ソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキ シル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-52)	(3 S) - 1 - エチル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチ ルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-53)	(3 S) - 1 - (1 - プロピルブチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシ ル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

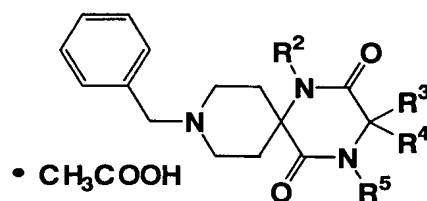
表 13A-8

実施例番号	化合物名
19 (H13-54)	(3 S) - 1 - (3 - メトキシプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-55)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 4 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-56)	(3 S) - 1 - ((3 - クロロフェニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-57)	(3 S) - 1 - (3 - メチルチオプロピル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-58)	(3 S) - 1 - (2 - (チオフェン - 2 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-59)	(3 S) - 1 - (2 - (1, 1 - ジメチルエチルチオ) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-60)	(3 S) - 1 - ((t - ブトキシカルボニル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 13A-9

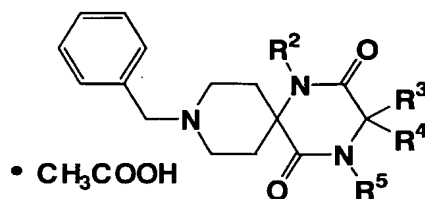
実施例番号	化合物名
19 (H13-61)	(3 S) - 1 - ((5 - メチルフラン - 2 - イル) メチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
19 (H13-62)	(3 S) - 1 - (2 - (ピリジン - 3 - イル) エチル) - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (2 - メチルプロピル) - 9 - (6 - フェニルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 1B-1



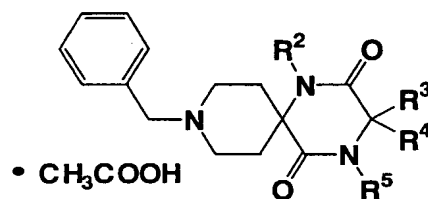
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-1)		H		H
19 (H1-2)		H		H
19 (H1-3)		H		H
19 (H1-4)		H	H	H
19 (H1-5)		H		H
19 (H1-6)		H		H
19 (H1-7)		H		H
19 (H1-8)		H		H

表 1B-2



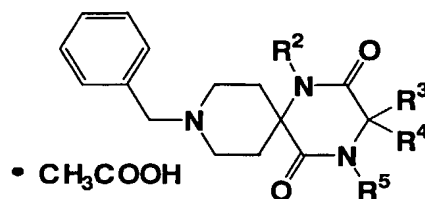
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-9)		H		H
19 (H1-10)		H		H
19 (H1-11)		H		H
19 (H1-12)		H		H
19 (H1-13)		H		H
19 (H1-14)		H	H	H
19 (H1-15)		H		H
19 (H1-16)		H		H

表 1B-3



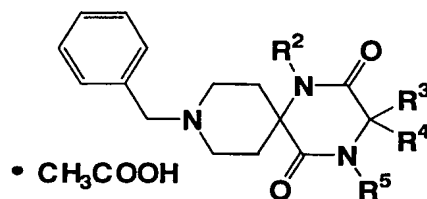
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-17)		H		H
19 (H1-18)		H		H
19 (H1-19)		H		H
19 (H1-20)		H		H
19 (H1-21)		H	H	H
19 (H1-22)		H		H
19 (H1-23)		H		H

表 1B-4



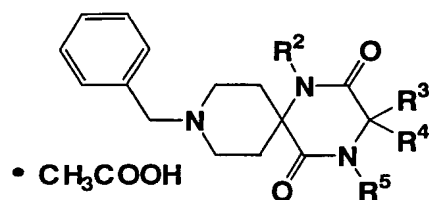
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-24)		H		H
19 (H1-25)		H		H
19 (H1-26)		H		H
19 (H1-27)		H		H
19 (H1-28)		H	H	H
19 (H1-29)		H		H
19 (H1-30)		H		H
19 (H1-31)		H		H

表 1B-5



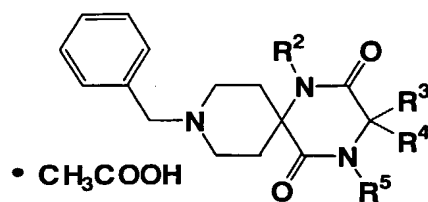
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-32)		H		H
19 (H1-33)		H		H
19 (H1-34)		H		H
19 (H1-35)		H	H	H
19 (H1-36)		H		H
19 (H1-37)		H		H
19 (H1-38)		H		H
19 (H1-39)		H		H
19 (H1-40)		H		H

表 1B-6



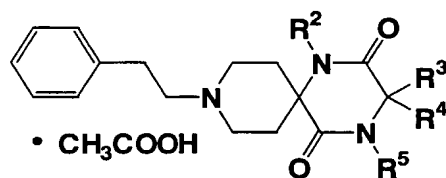
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-41)		H		H
19 (H1-42)		H	H	H
19 (H1-43)		H		H
19 (H1-44)		H		H
19 (H1-45)		H		H
19 (H1-46)		H		H
19 (H1-47)		H		H
19 (H1-48)		H		H

表 1B-7



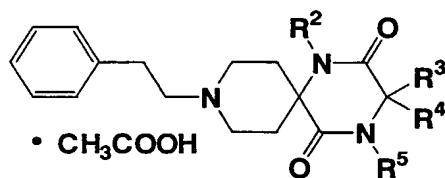
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H1-49)		H	H	H
19 (H1-50)		H		H
19 (H1-51)		H		H
19 (H1-52)		H		H
19 (H1-53)		H		H
19 (H1-54)		H		H
19 (H1-55)		H		H

表 2B-1



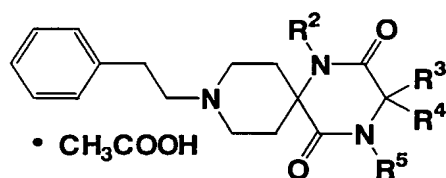
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-1)		H	H	H
19 (H2-2)		H		H
19 (H2-3)		H		H
19 (H2-4)		H		H
19 (H2-5)		H		H
19 (H2-6)		H	H	H
19 (H2-7)		H		H
19 (H2-8)		H		H

表 2B-2



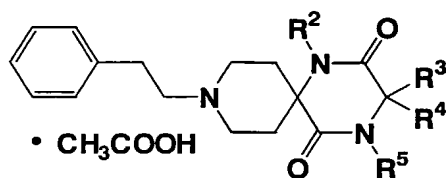
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-9)		H		H
19 (H2-10)		H		H
19 (H2-11)		H		H
19 (H2-12)		H		H
19 (H2-13)		H	H	H
19 (H2-14)		H		H
19 (H2-15)		H		H

表 2B-3



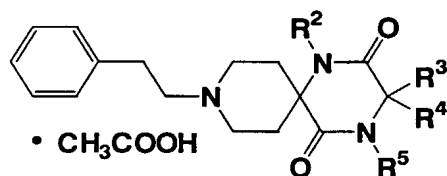
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-16)		H		H
19 (H2-17)		H		H
19 (H2-18)		H		H
19 (H2-19)		H		H
19 (H2-20)		H	H	H
19 (H2-21)		H		H
19 (H2-22)		H		H
19 (H2-23)		H		H

表 2B-4



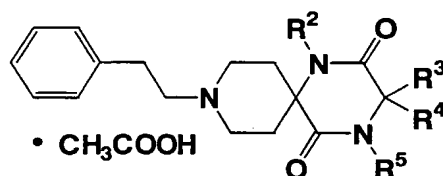
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-24)		H		H
19 (H2-25)		H		H
19 (H2-26)		H		H
19 (H2-27)		H	H	H
19 (H2-28)		H		H
19 (H2-29)		H		H
19 (H2-30)		H		H
19 (H2-31)		H		H

表 2B-5



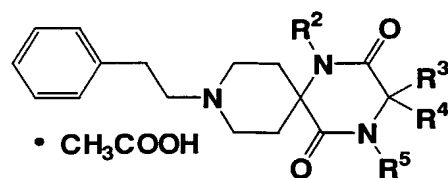
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-32)		H		H
19 (H2-33)		H		H
19 (H2-34)		H	H	H
19 (H2-35)		H		H
19 (H2-36)		H		H
19 (H2-37)		H		H
19 (H2-38)		H		H
19 (H2-39)		H		H

表 2B-6



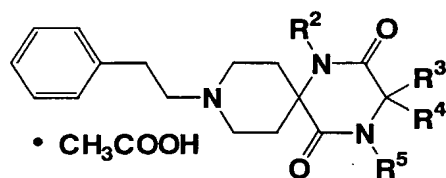
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-40)		H		H
19 (H2-41)		H	H	H
19 (H2-42)		H		H
19 (H2-43)		H		H
19 (H2-44)		H		H
19 (H2-45)		H		H
19 (H2-46)		H		H
19 (H2-47)		H		H
19 (H2-48)		H	H	H

表 2B-7



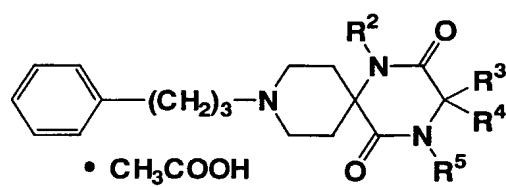
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-49)		H		H
19 (H2-50)		H		H
19 (H2-51)		H		H
19 (H2-52)		H		H
19 (H2-53)		H		H
19 (H2-54)		H		H
19 (H2-55)		H	H	H
19 (H2-56)		H		H

表 2B-8



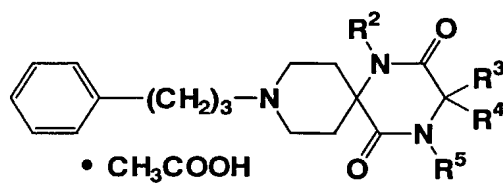
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H2-57)		H		H
19 (H2-58)		H		H
19 (H2-59)		H		H
19 (H2-60)		H		H
19 (H2-61)		H		H

表 3B-1



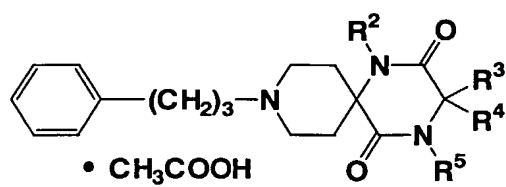
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-1)		H	H	H
19 (H3-2)		H		H
19 (H3-3)		H		H
19 (H3-4)		H		H
19 (H3-5)		H		H
19 (H3-6)		H		H
19 (H3-7)		H		H
19 (H3-8)		H	H	H

表 3B-2



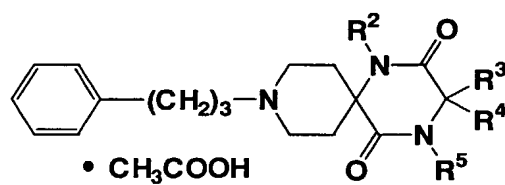
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-9)		H		H
19 (H3-10)		H		H
19 (H3-11)		H		H
19 (H3-12)		H		H
19 (H3-13)		H		H
19 (H3-14)		H		H
19 (H3-15)		H	H	H
19 (H3-16)		H		H

表 3B-3



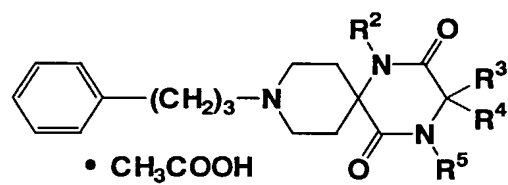
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-17)		H		H
19 (H3-18)		H		H
19 (H3-19)		H		H
19 (H3-20)		H		H
19 (H3-21)		H		H
19 (H3-22)		H	H	H
19 (H3-23)		H		H
19 (H3-24)		H		H

表 3B-4



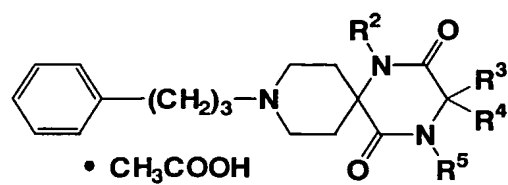
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-25)		H		H
19 (H3-26)		H		H
19 (H3-27)		H		H
19 (H3-28)		H		H
19 (H3-29)		H	H	H
19 (H3-30)		H		H
19 (H3-31)		H		H

表 3B-5



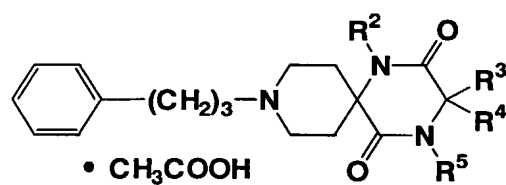
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-32)		H		H
19 (H3-33)		H		H
19 (H3-34)		H		H
19 (H3-35)		H		H
19 (H3-36)		H	H	H
19 (H3-37)		H		H
19 (H3-38)		H		H
19 (H3-39)		H		H

表 3B-6



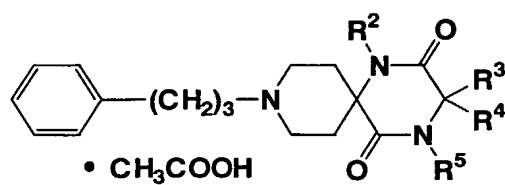
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-40)		H		H
19 (H3-41)		H		H
19 (H3-42)		H		H
19 (H3-43)		H	H	H
19 (H3-44)		H		H
19 (H3-45)		H		H
19 (H3-46)		H		H
19 (H3-47)		H		H
19 (H3-48)		H		H

表 3B-7



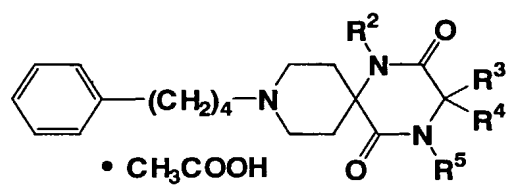
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-49)		H		H
19 (H3-50)		H	H	H
19 (H3-51)		H		H
19 (H3-52)		H		H
19 (H3-53)		H		H
19 (H3-54)		H		H
19 (H3-55)		H		H
19 (H3-56)		H		H

表 3B-8



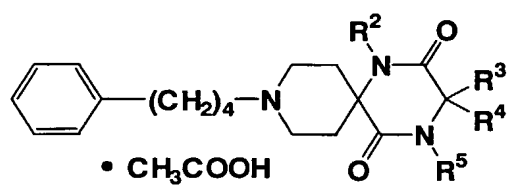
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H3-57)		H	H	H
19 (H3-58)		H		H
19 (H3-59)		H		H
19 (H3-60)		H		H
19 (H3-61)		H		H
19 (H3-62)		H		H
19 (H3-63)		H		H

表 4B-1



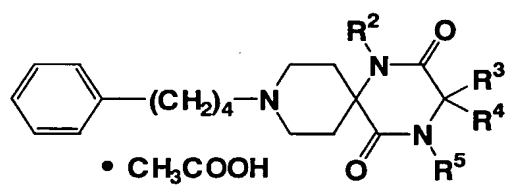
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-1)		H	H	H
19 (H4-2)		H		H
19 (H4-3)		H		H
19 (H4-4)		H		H
19 (H4-5)		H		H
19 (H4-6)		H		H
19 (H4-7)		H		H
19 (H4-8)		H	H	H

表 4B-2



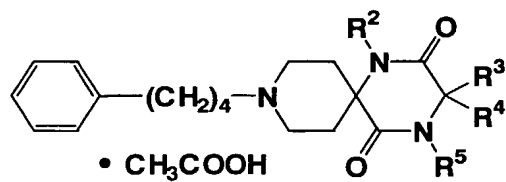
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-9)		H		H
19 (H4-10)		H		H
19 (H4-11)		H		H
19 (H4-12)		H		H
19 (H4-13)		H		H
19 (H4-14)		H		H
19 (H4-15)		H	H	H
19 (H4-16)		H		H

表 4B-3



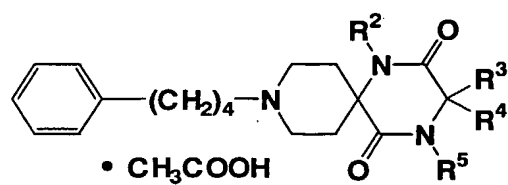
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-17)		H		H
19 (H4-18)		H		H
19 (H4-19)		H		H
19 (H4-20)		H		H
19 (H4-21)		H		H
19 (H4-22)		H	H	H
19 (H4-23)		H		H
19 (H4-24)		H		H

表 4B-4



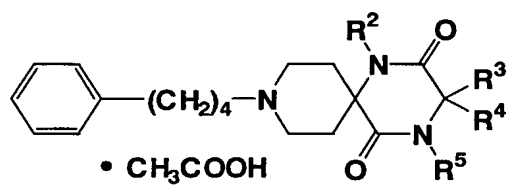
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-25)		H		H
19 (H4-26)		H		H
19 (H4-27)		H		H
19 (H4-28)		H		H
19 (H4-29)		H	H	H
19 (H4-30)		H		H
19 (H4-31)		H		H

表 4B-5



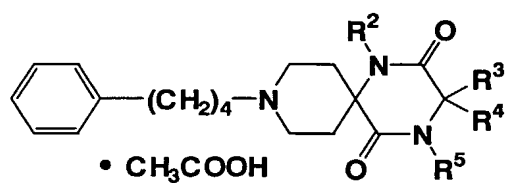
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-32)		H		H
19 (H4-33)		H		H
19 (H4-34)		H		H
19 (H4-35)		H		H
19 (H4-36)		H	H	H
19 (H4-37)		H		H
19 (H4-38)		H		H
19 (H4-39)		H		H

表 4B-6



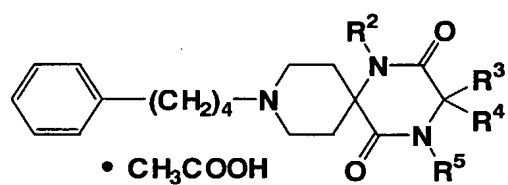
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-40)		H		H
19 (H4-41)		H		H
19 (H4-42)		H		H
19 (H4-43)		H	H	H
19 (H4-44)		H		H
19 (H4-45)		H		H
19 (H4-46)		H		H
19 (H4-47)		H		H
19 (H4-48)		H		H

表 4B-7



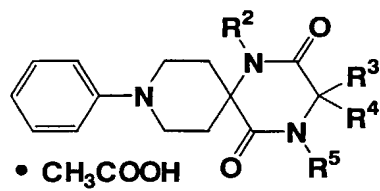
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-49)		H		H
19 (H4-50)		H	H	H
19 (H4-51)		H		H
19 (H4-52)		H		H
19 (H4-53)		H		H
19 (H4-54)		H		H
19 (H4-55)		H		H
19 (H4-56)		H		H

表 4B-8



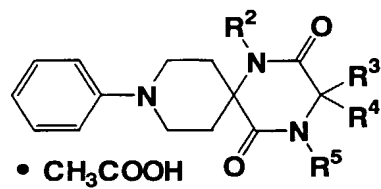
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H4-57)		H	H	H
19 (H4-58)		H		H
19 (H4-59)		H		H
19 (H4-60)		H		H
19 (H4-61)		H		H
19 (H4-62)		H		H
19 (H4-63)		H		H

表 5B-1



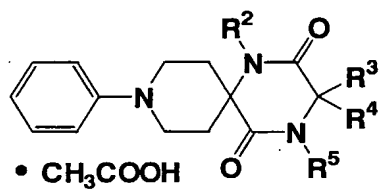
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-1)		H	H	H
19 (H5-2)		H		H
19 (H5-3)		H		H
19 (H5-4)		H		H
19 (H5-5)		H		H
19 (H5-6)		H		H
19 (H5-7)		H		H
19 (H5-8)		H	H	H

表 5B-2



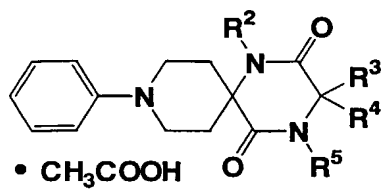
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-9)		H		H
19 (H5-10)		H		H
19 (H5-11)		H		H
19 (H5-12)		H		H
19 (H5-13)		H		H
19 (H5-14)		H		H
19 (H5-15)		H	H	H
19 (H5-16)		H		H

表 5B-3



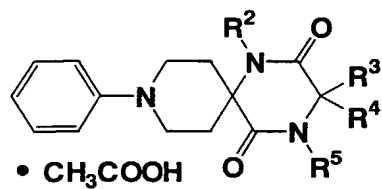
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-17)		H		H
19 (H5-18)		H		H
19 (H5-19)		H		H
19 (H5-20)		H		H
19 (H5-21)		H		H
19 (H5-22)		H	H	H
19 (H5-23)		H		H
19 (H5-24)		H		H

表 5B-4



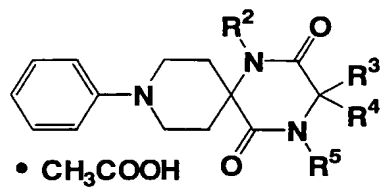
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-25)		H		H
19 (H5-26)		H		H
19 (H5-27)		H		H
19 (H5-28)		H		H
19 (H5-29)		H	H	H
19 (H5-30)		H		H
19 (H5-31)		H		H

表 5B-5



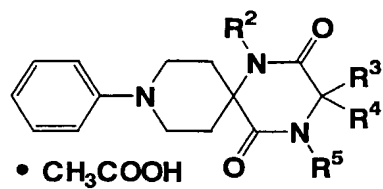
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-32)		H		H
19 (H5-33)		H		H
19 (H5-34)		H		H
19 (H5-35)		H		H
19 (H5-36)		H	H	H
19 (H5-37)		H		H
19 (H5-38)		H		H
19 (H5-39)		H		H

表 5B-6



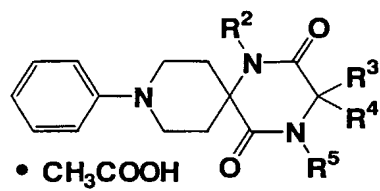
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-40)		H		H
19 (H5-41)		H		H
19 (H5-42)		H		H
19 (H5-43)		H	H	H
19 (H5-44)		H		H
19 (H5-45)		H		H
19 (H5-46)		H		H
19 (H5-47)		H		H
19 (H5-48)		H		H

表 5B-7



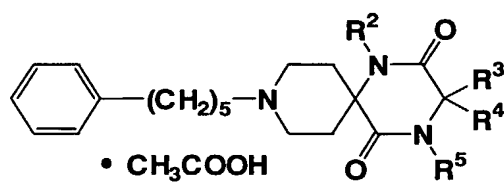
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-49)		H		H
19 (H5-50)		H	H	H
19 (H5-51)		H		H
19 (H5-52)		H		H
19 (H5-53)		H		H
19 (H5-54)		H		H
19 (H5-55)		H		H
19 (H5-56)		H		H

表 5B-8



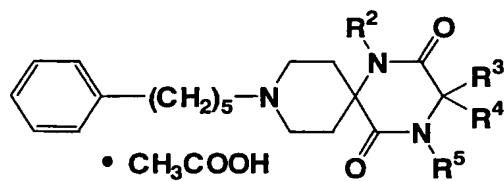
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H5-57)		H		H
19 (H5-58)		H		H
19 (H5-59)		H		H
19 (H5-60)		H		H
19 (H5-61)		H		H
19 (H5-62)		H		H

表 6B-1



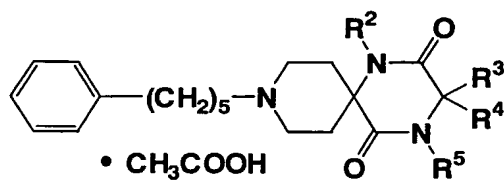
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-1)		H	H	H
19 (H6-2)		H		H
19 (H6-3)		H	H	H
19 (H6-4)		H		H
19 (H6-5)		H		H
19 (H6-6)		H		H
19 (H6-7)		H		H
19 (H6-8)		H		H

表 6B-2



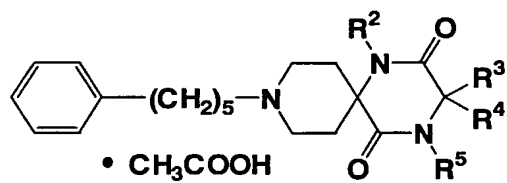
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-9)		H		H
19 (H6-10)		H	H	H
19 (H6-11)		H		H
19 (H6-12)		H		H
19 (H6-13)		H		H
19 (H6-14)		H		H
19 (H6-15)		H		H
19 (H6-16)		H		H

表 6B-3



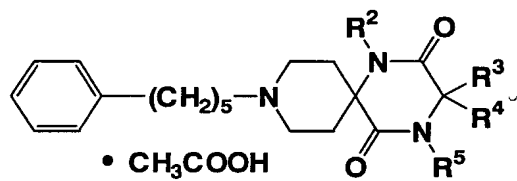
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-17)		H	H	H
19 (H6-18)		H		H
19 (H6-19)		H		H
19 (H6-20)		H		H
19 (H6-21)		H		H
19 (H6-22)		H		H
19 (H6-23)		H		H
19 (H6-24)		H	H	H

表 6B-4



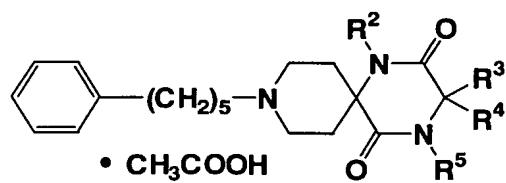
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-25)		H		H
19 (H6-26)		H		H
19 (H6-27)		H		H
19 (H6-28)		H		H
19 (H6-29)		H		H
19 (H6-30)		H		H
19 (H6-31)		H	H	H
19 (H6-32)		H		H

表 6B-5



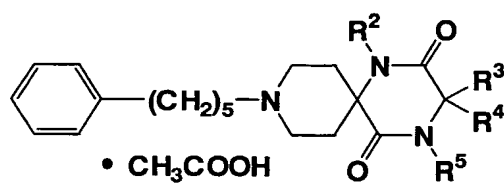
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-33)		H		H
19 (H6-34)		H		H
19 (H6-35)		H		H
19 (H6-36)		H		H
19 (H6-37)		H		H
19 (H6-38)		H	H	H
19 (H6-39)		H		H
19 (H6-40)		H		H

表 6B-6



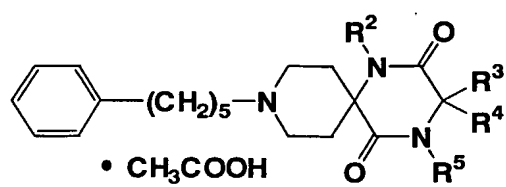
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-41)		H		H
19 (H6-42)		H		H
19 (H6-43)		H		H
19 (H6-44)		H		H
19 (H6-45)		H	H	H
19 (H6-46)		H		H
19 (H6-47)		H		H
19 (H6-48)		H		H

表 6B-7



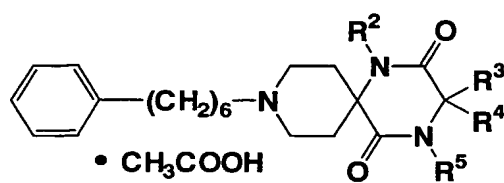
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-49)		H		H
19 (H6-50)		H		H
19 (H6-51)		H		H
19 (H6-52)		H	H	H
19 (H6-53)		H		H
19 (H6-54)		H		H
19 (H6-55)		H		H
19 (H6-56)		H		H

表 6B-8



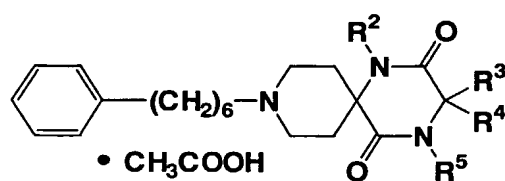
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H6-57)		H		H
19 (H6-58)		H		H

表 7B-1



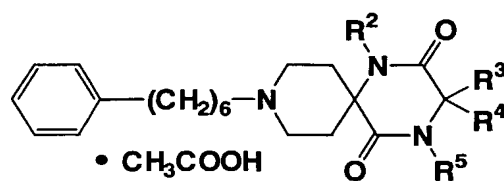
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-1)		H	H	H
19 (H7-2)		H		H
19 (H7-3)		H		H
19 (H7-4)		H		H
19 (H7-5)		H		H
19 (H7-6)		H	H	H
19 (H7-7)		H		H
19 (H7-8)		H		H

表 7B-2



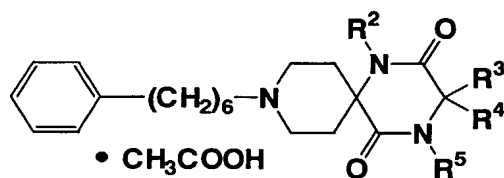
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-9)		H		H
19 (H7-10)		H		H
19 (H7-11)		H		H
19 (H7-12)		H		H
19 (H7-13)		H	H	H
19 (H7-14)		H		H
19 (H7-15)		H		H

表 7B-3



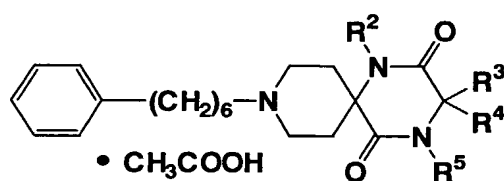
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-16)		H		H
19 (H7-17)		H		H
19 (H7-18)		H		H
19 (H7-19)		H		H
19 (H7-20)		H	H	H
19 (H7-21)		H		H
19 (H7-22)		H		H
19 (H7-23)		H		H

表 7B-4



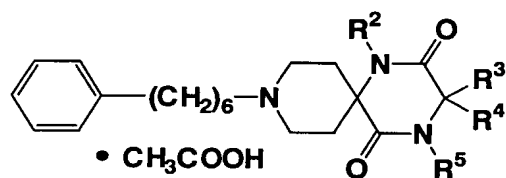
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-24)		H		H
19 (H7-25)		H		H
19 (H7-26)		H		H
19 (H7-27)		H	H	H
19 (H7-28)		H		H
19 (H7-29)		H		H
19 (H7-30)		H		H
19 (H7-31)		H		H

表 7B-5



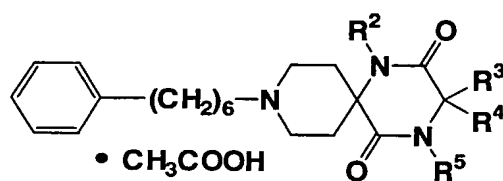
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-32)		H		H
19 (H7-33)		H		H
19 (H7-34)		H		H
19 (H7-35)		H		H
19 (H7-36)		H		H
19 (H7-37)		H		H
19 (H7-38)		H		H
19 (H7-39)		H		H

表 7B-6



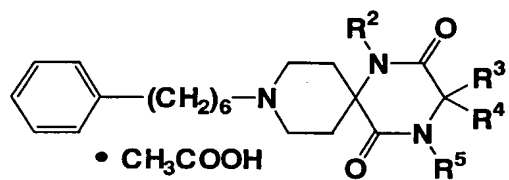
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-40)		H	H	H
19 (H7-41)		H		H
19 (H7-42)		H		H
19 (H7-43)		H		H
19 (H7-44)		H		H
19 (H7-45)		H		H
19 (H7-46)		H		H
19 (H7-47)		H	H	H
19 (H7-48)		H		H

表 7B-7



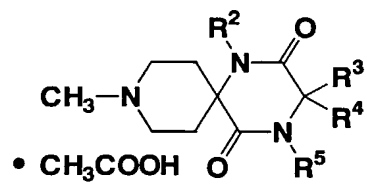
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-49)		H		H
19 (H7-50)		H		H
19 (H7-51)		H		H
19 (H7-52)		H		H
19 (H7-53)		H		H
19 (H7-54)		H	H	H
19 (H7-55)		H		H
19 (H7-56)		H		H

表 7B-8



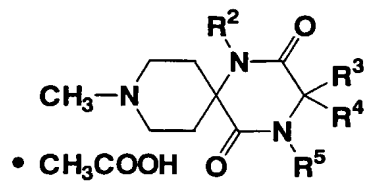
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H7-57)		H		H
19 (H7-58)		H		H
19 (H7-59)		H		H
19 (H7-60)		H		H

表 8B-1



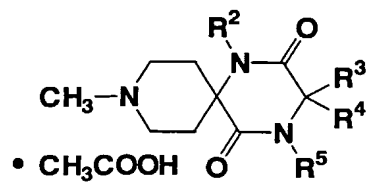
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-1)		H		H
19 (H8-2)		H		H
19 (H8-3)		H	H	H
19 (H8-4)		H		H
19 (H8-5)		H		H
19 (H8-6)		H		H
19 (H8-7)		H		H
19 (H8-8)		H		H

表 8B-2



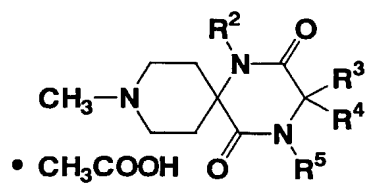
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-9)		H		H
19 (H8-10)		H	H	H
19 (H8-11)		H		H
19 (H8-12)		H		H
19 (H8-13)		H		H
19 (H8-14)		H		H
19 (H8-15)		H		H
19 (H8-16)		H		H

表 8B-3



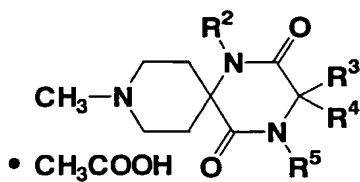
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-17)		H	H	H
19 (H8-18)		H		H
19 (H8-19)		H		H
19 (H8-20)		H		H
19 (H8-21)		H		H
19 (H8-22)		H		H
19 (H8-23)		H		H
19 (H8-24)		H	H	H

表 8B-4



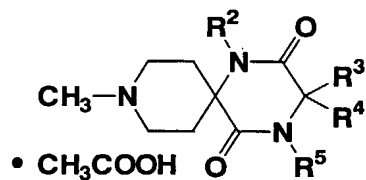
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-25)		H		H
19 (H8-26)		H		H
19 (H8-27)		H		H
19 (H8-28)		H		H
19 (H8-29)		H		H
19 (H8-30)		H		H
19 (H8-31)		H	H	H
19 (H8-32)		H		H

表 8B-5



実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-33)		H		H
19 (H8-34)		H		H
19 (H8-35)		H		H
19 (H8-36)		H		H
19 (H8-37)		H		H
19 (H8-38)		H	H	H
19 (H8-39)		H		H
19 (H8-40)		H		H

表 8B-6



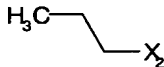
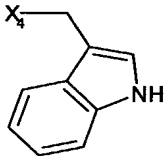
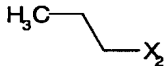
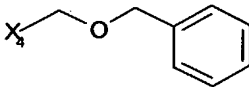
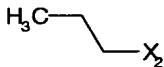
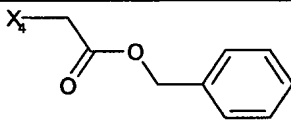
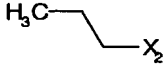
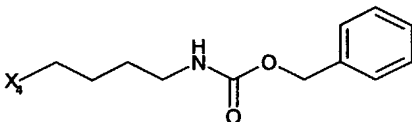
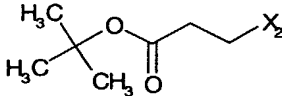
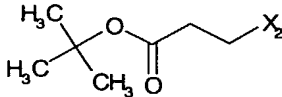
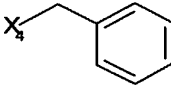
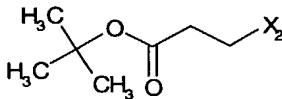
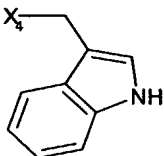
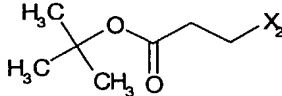
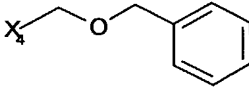
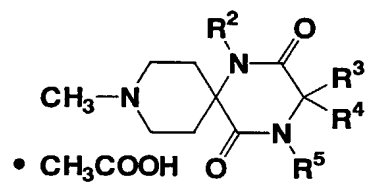
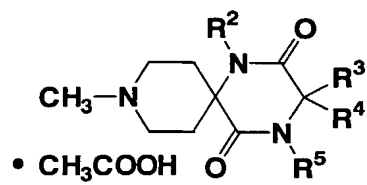
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-41)		H		H
19 (H8-42)		H		H
19 (H8-43)		H		H
19 (H8-44)		H		H
19 (H8-45)		H	H	H
19 (H8-46)		H		H
19 (H8-47)		H		H
19 (H8-48)		H		H

表 8B-7



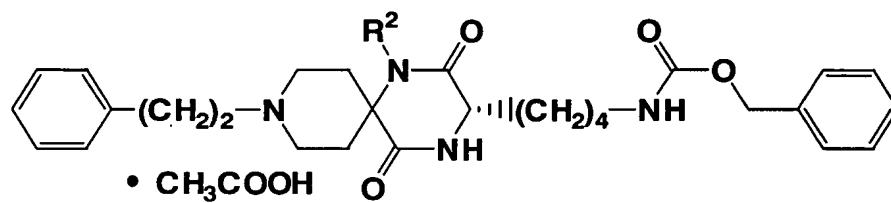
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-49)		H		H
19 (H8-50)		H		H
19 (H8-51)		H	H	H
19 (H8-52)		H		H
19 (H8-53)		H		H
19 (H8-54)		H		H
19 (H8-55)		H		H
19 (H8-56)		H		H

表 8B-8



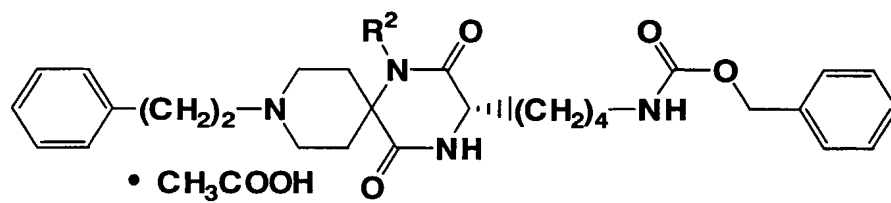
実施例番号	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵
19 (H8-57)		H		H

表 9B-1



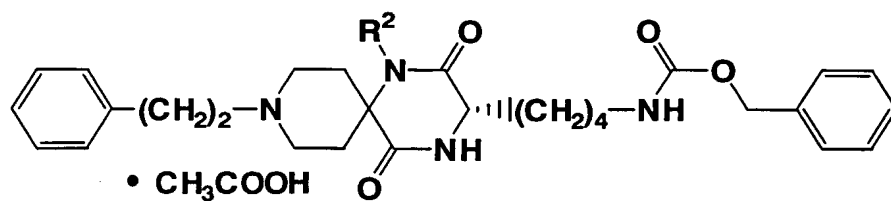
実施例番号	R ²
19 (H9-1)	
19 (H9-2)	
19 (H9-3)	
19 (H9-4)	
19 (H9-5)	
19 (H9-6)	
19 (H9-7)	
19 (H9-8)	

表 9B-2



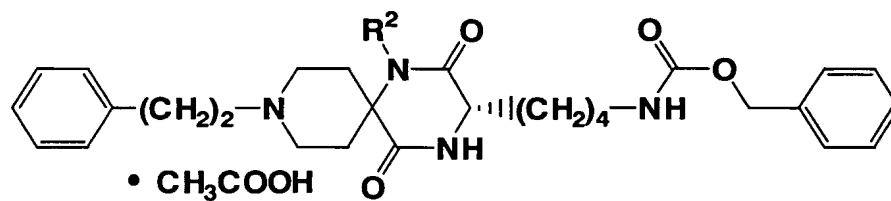
実施例番号	R ²
19 (H9-9)	
19 (H9-10)	
19 (H9-11)	
19 (H9-12)	
19 (H9-13)	
19 (H9-14)	
19 (H9-15)	
19 (H9-16)	

表 9B-3



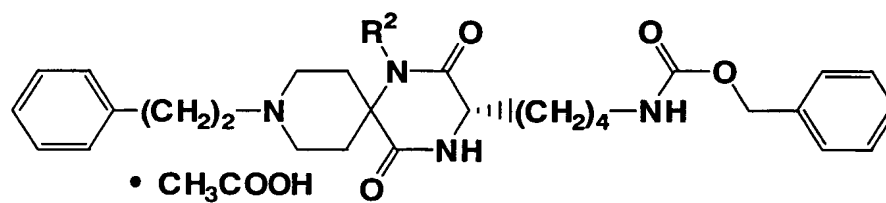
実施例番号	R ²
19 (H9-17)	
19 (H9-18)	
19 (H9-19)	
19 (H9-20)	
19 (H9-21)	
19 (H9-22)	
19 (H9-23)	
19 (H9-24)	

表 9B-4



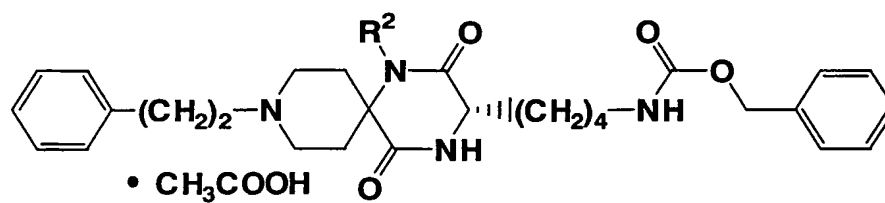
実施例番号	R ²
19 (H9-25)	
19 (H9-26)	
19 (H9-27)	
19 (H9-28)	
19 (H9-29)	
19 (H9-30)	
19 (H9-31)	
19 (H9-32)	

表 9B-5



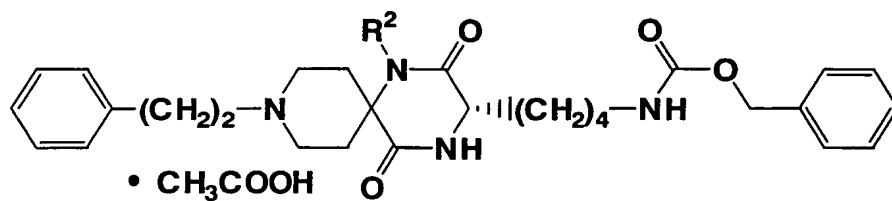
実施例番号	R ²
19 (H9-33)	
19 (H9-34)	
19 (H9-35)	
19 (H9-36)	
19 (H9-37)	
19 (H9-38)	
19 (H9-39)	
19 (H9-40)	
19 (H9-41)	
19 (H9-42)	
19 (H9-43)	

表 9B-6



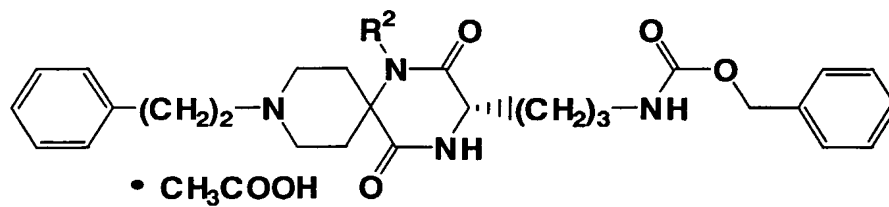
実施例番号	R ²
19 (H9-44)	
19 (H9-45)	
19 (H9-46)	
19 (H9-47)	
19 (H9-48)	
19 (H9-49)	
19 (H9-50)	
19 (H9-51)	
19 (H9-52)	
19 (H9-53)	
19 (H9-54)	

表 9B-7



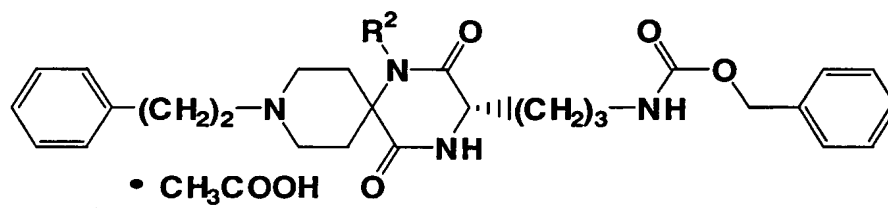
実施例番号	R ²
19 (H9-55)	
19 (H9-56)	
19 (H9-57)	
19 (H9-58)	
19 (H9-59)	
19 (H9-60)	
19 (H9-61)	
19 (H9-62)	

表 10B-1



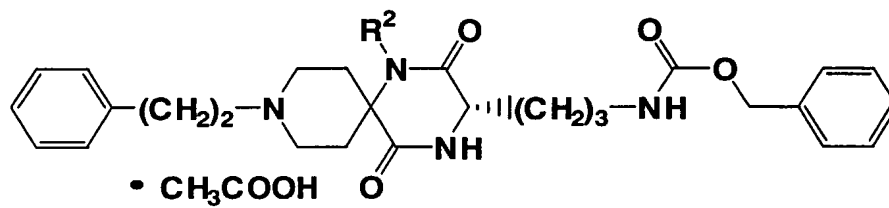
実施例番号	R ²
19 (H10-1)	
19 (H10-2)	
19 (H10-3)	
19 (H10-4)	
19 (H10-5)	
19 (H10-6)	
19 (H10-7)	
19 (H10-8)	

表 10B-2



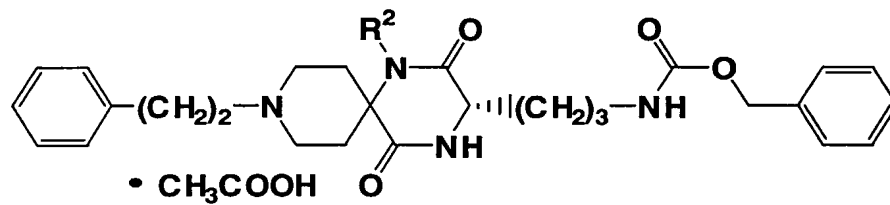
実施例番号	R ²
19 (H10-9)	
19 (H10-10)	
19 (H10-11)	
19 (H10-12)	
19 (H10-13)	
19 (H10-14)	
19 (H10-15)	
19 (H10-16)	

表 10B-3



実施例番号	R ²
19 (H10-17)	
19 (H10-18)	
19 (H10-19)	
19 (H10-20)	
19 (H10-21)	
19 (H10-22)	
19 (H10-23)	
19 (H10-24)	

表 10B-4



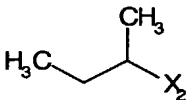
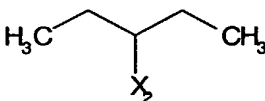
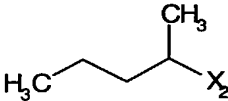
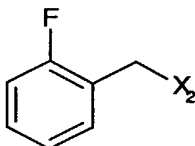
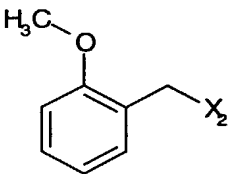
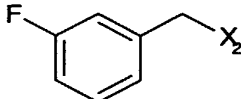
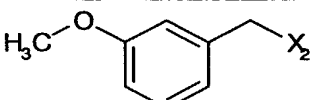
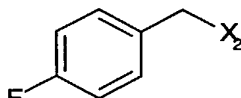
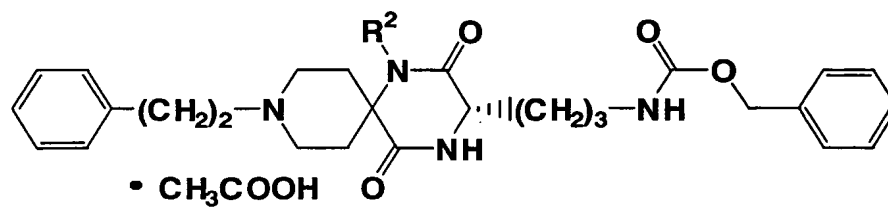
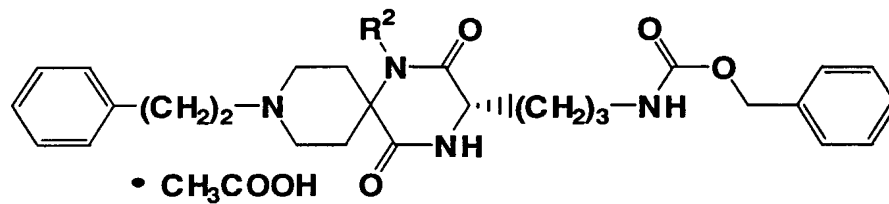
実施例番号	R ²
19 (H10-25)	
19 (H10-26)	
19 (H10-27)	
19 (H10-28)	
19 (H10-29)	
19 (H10-30)	
19 (H10-31)	
19 (H10-32)	

表 10B-5



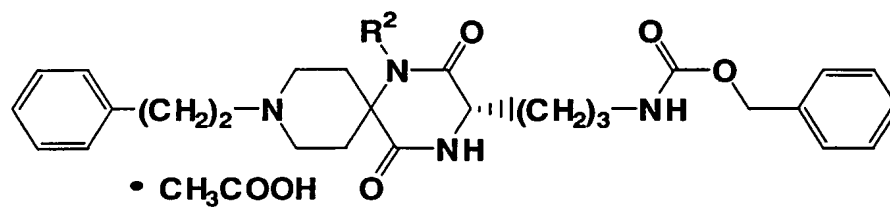
実施例番号	R ²
19 (H10-33)	
19 (H10-34)	
19 (H10-35)	
19 (H10-36)	
19 (H10-37)	
19 (H10-38)	
19 (H10-39)	
19 (H10-40)	
19 (H10-41)	

表 10B-6



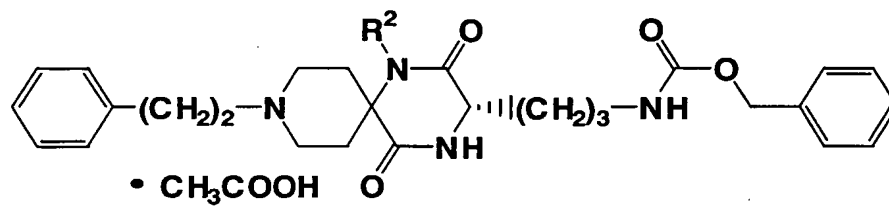
実施例番号	R ²
19 (H10-42)	
19 (H10-43)	
19 (H10-44)	
19 (H10-45)	
19 (H10-46)	
19 (H10-47)	
19 (H10-48)	
19 (H10-49)	
19 (H10-50)	
19 (H10-51)	
19 (H10-52)	
19 (H10-53)	

表 10B-7



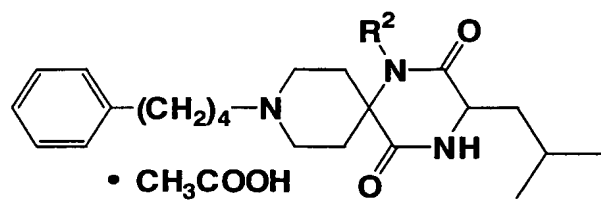
実施例番号	R ²
19 (H10-54)	
19 (H10-55)	
19 (H10-56)	
19 (H10-57)	
19 (H10-58)	
19 (H10-59)	
19 (H10-60)	
19 (H10-61)	
19 (H10-62)	

表 10B-8



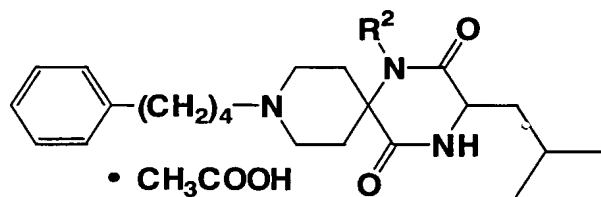
実施例番号	R ²
19 (H10-63)	
19 (H10-64)	
19 (H10-65)	
19 (H10-66)	
19 (H10-67)	
19 (H10-68)	

表 11B-1



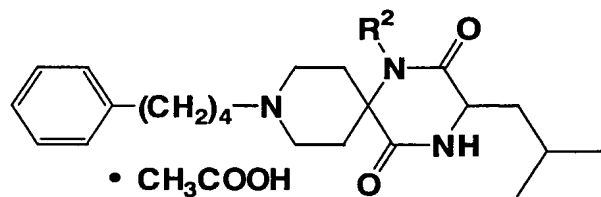
実施例番号	R ²
19 (H11-1)	
19 (H11-2)	
19 (H11-3)	
19 (H11-4)	
19 (H11-5)	
19 (H11-6)	
19 (H11-7)	
19 (H11-8)	

表 11B-2



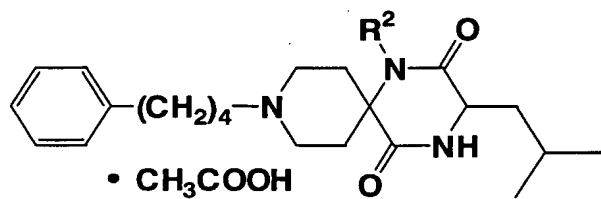
実施例番号	R ²
19 (H11-9)	
19 (H11-10)	
19 (H11-11)	
19 (H11-12)	
19 (H11-13)	
19 (H11-14)	
19 (H11-15)	
19 (H11-16)	

表 11B-3



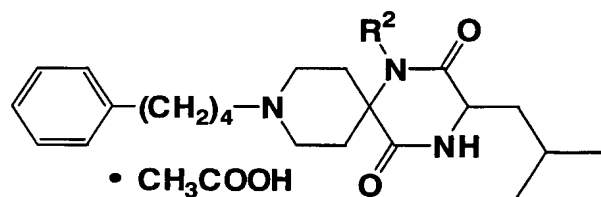
実施例番号	R ²
19 (H11-17)	
19 (H11-18)	
19 (H11-19)	
19 (H11-20)	
19 (H11-21)	
19 (H11-22)	
19 (H11-23)	
19 (H11-24)	

表 11B-4



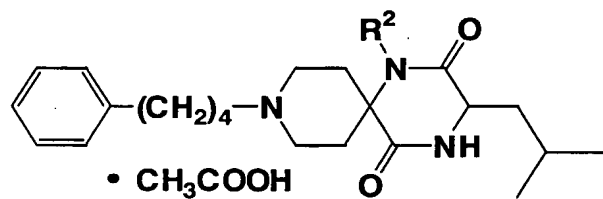
実施例番号	R ²
19 (H11-25)	
19 (H11-26)	
19 (H11-27)	
19 (H11-28)	
19 (H11-29)	
19 (H11-30)	
19 (H11-31)	
19 (H11-32)	
19 (H11-33)	

表 11B-5



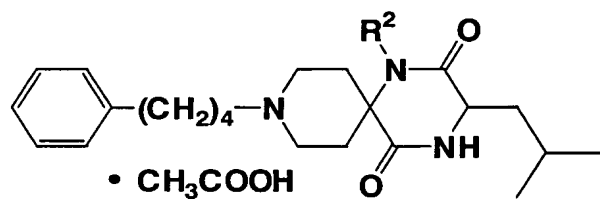
実施例番号	R ²
19 (H11-34)	$\text{H}_3\text{C}-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-35)	$\text{HC}\equiv\text{C}-\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-36)	$\text{H}_2\text{C}=\text{CH}-\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-37)	$\text{HO}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-38)	$\text{H}_3\text{C}-\text{CH}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-39)	$\text{H}_3\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-40)	$\text{H}_3\text{C}-\text{N}(\text{CH}_3)-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-41)	$\text{H}_3\text{C}-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-42)	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-43)	$\text{C}_6\text{H}_5-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-44)	$\text{H}_3\text{C}-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$
19 (H11-45)	$\text{N}(\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2)\text{CH}_2\text{CH}_2\text{X}_2$

表 11B-6



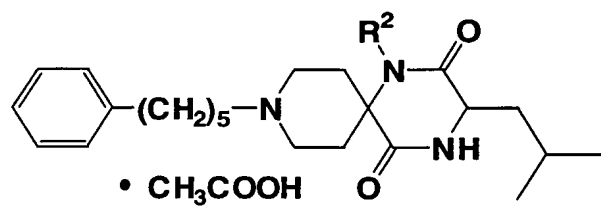
実施例番号	R ²
19 (H11-46)	
19 (H11-47)	
19 (H11-48)	
19 (H11-49)	
19 (H11-50)	
19 (H11-51)	
19 (H11-52)	
19 (H11-53)	
19 (H11-54)	
19 (H11-55)	

表 11B-7



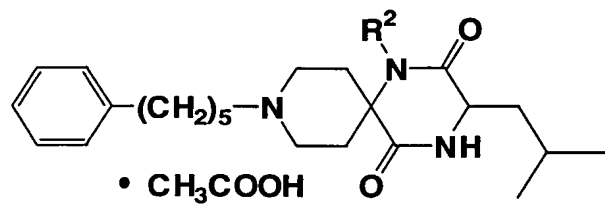
実施例番号	R ²
19 (H11-56)	
19 (H11-57)	
19 (H11-58)	

表 12B-1



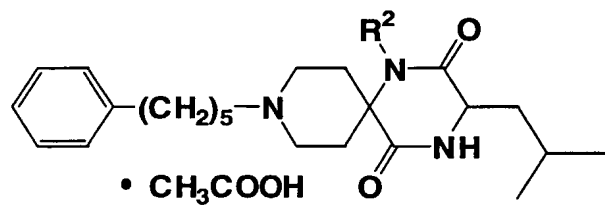
実施例番号	R ²
19 (H12-1)	
19 (H12-2)	
19 (H12-3)	
19 (H12-4)	
19 (H12-5)	
19 (H12-6)	
19 (H12-7)	
19 (H12-8)	

表 12B-2



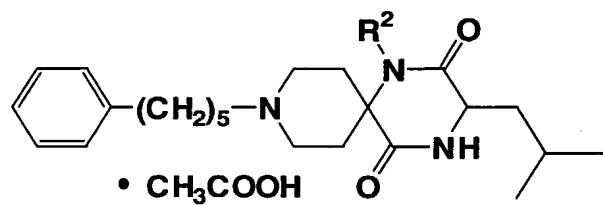
実施例番号	R ²
19 (H12-9)	
19 (H12-10)	
19 (H12-11)	
19 (H12-12)	
19 (H12-13)	
19 (H12-14)	
19 (H12-15)	
19 (H12-16)	

表 12B-3



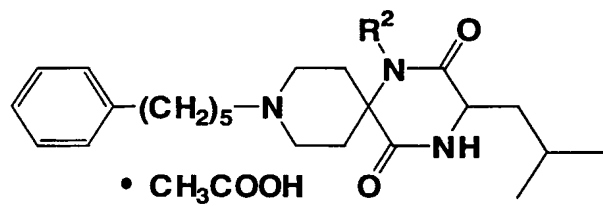
実施例番号	R ²
19 (H12-17)	
19 (H12-18)	
19 (H12-19)	
19 (H12-20)	
19 (H12-21)	
19 (H12-22)	
19 (H12-23)	
19 (H12-24)	

表 12B-4



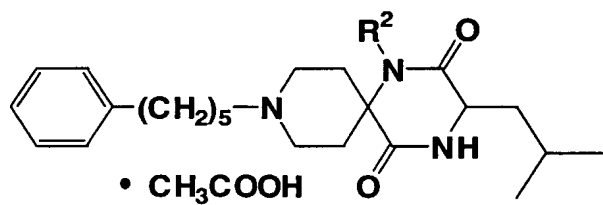
実施例番号	R ²
19 (H12-25)	
19 (H12-26)	
19 (H12-27)	
19 (H12-28)	
19 (H12-29)	
19 (H12-30)	
19 (H12-31)	
19 (H12-32)	

表 12B-5



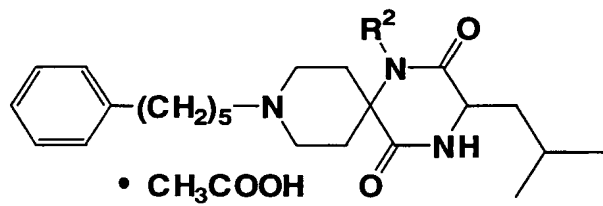
実施例番号	R ²
19 (H12-33)	
19 (H12-34)	
19 (H12-35)	
19 (H12-36)	
19 (H12-37)	
19 (H12-38)	
19 (H12-39)	
19 (H12-40)	
19 (H12-41)	

表 12B-6



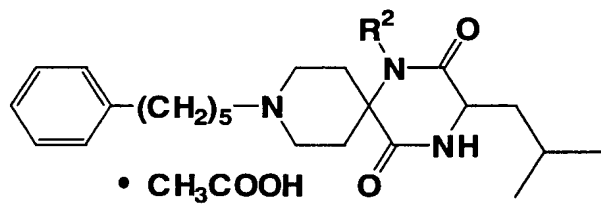
実施例番号	R ²
19 (H12-42)	
19 (H12-43)	
19 (H12-44)	
19 (H12-45)	
19 (H12-46)	
19 (H12-47)	
19 (H12-48)	
19 (H12-49)	
19 (H12-50)	
19 (H12-51)	
19 (H12-52)	
19 (H12-53)	

表 12B-7



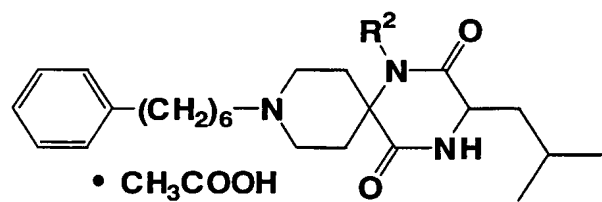
実施例番号	R ²
19 (H12-54)	
19 (H12-55)	
19 (H12-56)	
19 (H12-57)	
19 (H12-58)	
19 (H12-59)	
19 (H12-60)	
19 (H12-61)	
19 (H12-62)	
19 (H12-63)	

表 12B-8



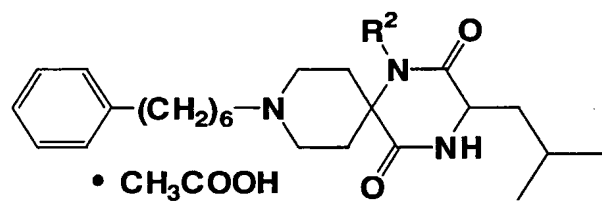
実施例番号	R ²
19 (H12-64)	
19 (H12-65)	
19 (H12-66)	
19 (H12-67)	
19 (H12-68)	
19 (H12-69)	

表 13B-1



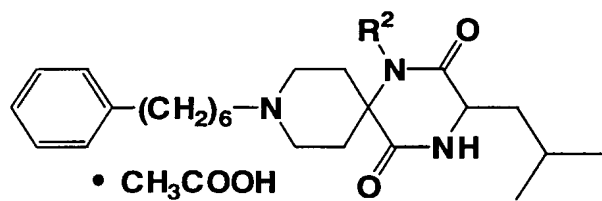
実施例番号	R ²
19 (H13-1)	
19 (H13-2)	
19 (H13-3)	
19 (H13-4)	
19 (H13-5)	
19 (H13-6)	
19 (H13-7)	
19 (H13-8)	

表 13B-2



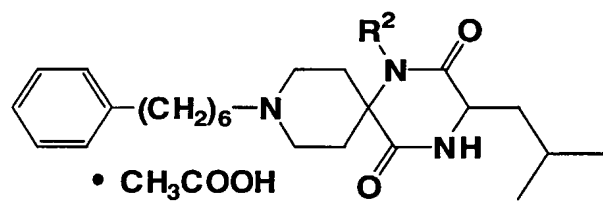
実施例番号	R ²
19 (H13-9)	
19 (H13-10)	
19 (H13-11)	
19 (H13-12)	
19 (H13-13)	
19 (H13-14)	
19 (H13-15)	
19 (H13-16)	

表 13B-3



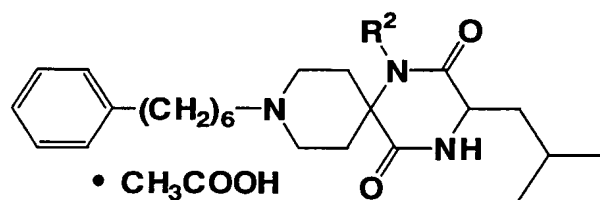
実施例番号	R ²
19 (H13-17)	
19 (H13-18)	
19 (H13-19)	
19 (H13-20)	
19 (H13-21)	
19 (H13-22)	
19 (H13-23)	
19 (H13-24)	

表 13B-4



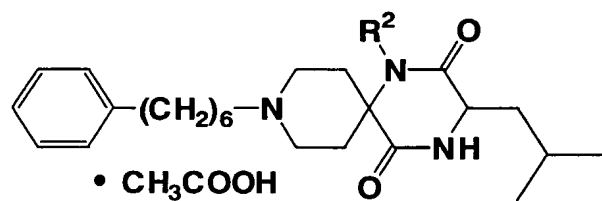
実施例番号	R ²
19 (H13-25)	
19 (H13-26)	
19 (H13-27)	
19 (H13-28)	
19 (H13-29)	
19 (H13-30)	
19 (H13-31)	
19 (H13-32)	

表 13B-5



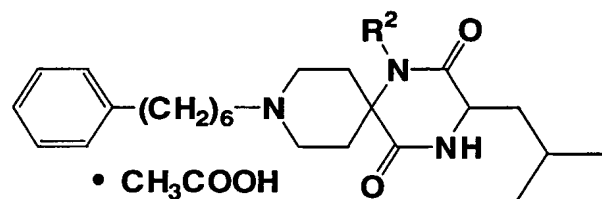
実施例番号	R ²
19 (H13-33)	
19 (H13-34)	
19 (H13-35)	
19 (H13-36)	
19 (H13-37)	
19 (H13-38)	
19 (H13-39)	
19 (H13-40)	
19 (H13-41)	
19 (H13-42)	
19 (H13-43)	
19 (H13-44)	

表 13B-6



実施例番号	R ²
19 (H13-45)	
19 (H13-46)	
19 (H13-47)	
19 (H13-48)	
19 (H13-49)	
19 (H13-50)	
19 (H13-51)	
19 (H13-52)	
19 (H13-53)	
19 (H13-54)	

表 13B-7



実施例番号	R ²
19 (H13-55)	
19 (H13-56)	
19 (H13-57)	
19 (H13-58)	
19 (H13-59)	
19 (H13-60)	
19 (H13-61)	
19 (H13-62)	

表 1C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H1-1)	F	3.16	410 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-2)	F	3.17	483 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-3)	F	4.24	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-4)	F	2.83	358 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-5)	F	3.09	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-6)	F	3.11	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-7)	F	3.11	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-8)	F	3.17	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-9)	F	3.23	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-10)	F	3.25	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-11)	F	3.35	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-12)	F	3.32	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-13)	F	3.37	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-14)	F	3.01	364 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-15)	F	3.25	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-16)	F	3.24	454 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-17)	F	3.23	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-18)	F	3.29	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-19)	F	3.36	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-20)	F	3.38	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-21)	F	3.26	454 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-22)	F	3.52	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-23)	F	3.51	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-24)	F	3.48	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-25)	F	3.53	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-26)	F	3.59	602 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 1C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H1-27)	F	3.56	659 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-28)	F	3.07	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-29)	F	3.31	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-30)	F	3.30	468 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-31)	F	3.29	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-32)	F	3.35	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-33)	F	3.40	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-34)	F	3.41	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-35)	F	2.84	316 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-36)	F	3.11	372 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-37)	F	3.11	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-38)	F	3.09	445 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-39)	F	3.18	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-40)	F	3.22	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-41)	F	3.26	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-42)	F	3.04	402 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-43)	F	3.34	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-44)	F	3.36	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-45)	F	3.30	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-46)	F	3.35	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-47)	F	3.39	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-48)	F	3.40	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-49)	F	2.85	433 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-50)	F	3.03	489 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-51)	F	3.05	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-52)	F	3.06	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 1C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H1-53)	F	3.11	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-54)	F	3.14	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H1-55)	F	3.16	638 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 2C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H2-1)	B	10.20	368 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H2-2)	F	3.23	497 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-3)	F	3.73	488 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-4)	F	3.72	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-5)	C	14.80	573 (M + H) ⁺ , 465.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H2-6)	F	2.91	372 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-7)	F	3.15	428 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-8)	F	3.17	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-9)	F	3.17	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-10)	F	3.24	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-11)	F	3.26	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-12)	F	3.30	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-13)	F	3.16	431 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-14)	F	3.37	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-15)	B	17.50	521 (M + H) ⁺ , 144.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H2-16)	F	3.34	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-17)	F	3.41	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-18)	F	3.44	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-19)	C	15.70	636 (M + H) ⁺ , 528, 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H2-20)	F	3.07	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-21)	F	3.30	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-22)	F	3.31	468 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-23)	F	3.30	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-24)	F	3.36	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-25)	F	3.41	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-26)	F	3.42	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 2C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H2-27)	F	3.33	468 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-28)	F	3.57	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-29)	F	3.55	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-30)	F	3.54	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-31)	F	3.60	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-32)	F	3.65	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-33)	F	3.60	673 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-34)	F	3.13	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-35)	F	3.37	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-36)	F	3.37	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-37)	F	3.35	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-38)	F	3.42	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-39)	F	3.46	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-40)	F	3.50	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-41)	F	2.92	330 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-42)	F	3.20	386 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-43)	F	3.17	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-44)	F	3.17	459 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-45)	F	3.26	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-46)	F	3.30	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-47)	F	3.32	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-48)	F	3.11	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-49)	F	3.36	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-50)	F	3.34	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-51)	F	3.33	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-52)	F	3.41	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 2C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H2-53)	F	3.50	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-54)	F	3.50	621 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-55)	F	2.92	447 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-56)	F	3.09	503 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-57)	F	3.09	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-58)	F	3.11	576 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-59)	F	3.18	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-60)	F	3.20	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H2-61)	F	3.24	652 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 3C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H3-1)	B	10.80	382 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H3-2)	F	3.27	438 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-3)	F	3.28	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-4)	F	3.27	511 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-5)	F	3.35	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-6)	F	3.37	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-7)	F	2.98	386 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-8)	F	3.22	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-9)	F	3.23	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-10)	F	3.23	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-11)	F	3.22	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-12)	F	3.29	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-13)	F	3.31	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-14)	F	3.34	591 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-15)	F	3.20	445 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-16)	F	3.43	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-17)	F	3.40	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-18)	F	3.39	571 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-19)	F	3.45	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-20)	F	3.49	593 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-21)	F	3.49	650 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-22)	F	3.13	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-23)	F	3.35	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-24)	F	3.34	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-25)	F	3.34	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-26)	F	3.42	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 3C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H3-27)	F	3.45	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-28)	F	3.46	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-29)	F	3.37	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-30)	F	3.61	538 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-31)	F	3.61	572 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-32)	F	3.57	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-33)	F	3.64	602 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-34)	F	3.68	630 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-35)	F	3.66	687 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-36)	F	3.20	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-37)	F	3.43	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-38)	F	3.42	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-39)	F	3.40	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-40)	F	3.48	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-41)	F	3.50	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-42)	F	3.51	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-43)	F	3.01	344 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-44)	F	3.23	400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-45)	F	3.24	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-46)	F	3.25	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-47)	F	3.30	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-48)	F	3.33	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-49)	F	3.37	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-50)	F	3.18	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-51)	F	3.40	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-52)	F	3.40	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 3C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H3-53)	F	3.40	559 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-54)	F	3.45	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-55)	F	3.49	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-56)	F	3.51	635 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-57)	F	2.98	461 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-58)	F	3.14	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-59)	F	3.14	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-60)	F	3.15	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-61)	F	3.21	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-62)	F	3.24	609 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H3-63)	F	3.27	666 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 4C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H4-1)	F	3.14	396 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-2)	F	3.36	453 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-3)	F	3.35	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-4)	F	3.36	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-5)	F	3.41	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-6)	F	3.45	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-7)	F	3.45	601 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-8)	F	3.05	400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-9)	F	3.29	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-10)	F	3.29	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-11)	F	3.29	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-12)	F	3.36	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-13)	F	3.38	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-14)	F	3.42	605 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-15)	F	3.26	459 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-16)	F	3.47	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-17)	F	3.47	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-18)	F	3.44	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-19)	F	3.51	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-20)	F	3.54	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-21)	F	3.55	664 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-22)	F	3.20	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-23)	F	3.44	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-24)	F	3.42	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-25)	F	3.42	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-26)	F	3.47	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 4C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H4-27)	F	3.51	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-28)	F	3.52	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-29)	F	3.43	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-30)	F	3.66	552 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-31)	F	3.66	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-32)	F	3.62	625 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-33)	F	3.68	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-34)	F	3.72	644 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-35)	F	3.69	701 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-36)	F	3.26	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-37)	F	3.48	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-38)	F	3.46	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-39)	F	3.46	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-40)	F	3.55	540 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-41)	F	3.56	568 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-42)	F	3.57	625 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-43)	F	3.09	358 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-44)	F	3.31	414 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-45)	F	3.31	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-46)	F	3.31	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-47)	F	3.38	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-48)	F	3.40	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-49)	F	3.43	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-50)	F	3.25	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-51)	F	3.50	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-52)	F	3.47	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 4C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H4-53)	F	3.46	573 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-54)	F	3.53	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-55)	F	3.55	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-56)	F	3.56	649 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-57)	F	3.05	475 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-58)	F	3.19	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-59)	F	3.20	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-60)	F	3.22	604 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-61)	F	3.27	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-62)	F	3.30	623 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H4-63)	F	3.33	680 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 5C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H5-1)	F	2.89	340 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-2)	F	3.17	396 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-3)	F	3.16	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-4)	F	3.14	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-5)	F	3.23	460 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-6)	F	3.29	488 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-7)	F	3.31	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-8)	F	2.79	344 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-9)	F	3.07	400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-10)	F	3.09	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-11)	F	3.07	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-12)	F	3.16	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-13)	F	3.20	492 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-14)	F	3.22	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-15)	F	3.08	403 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-16)	F	3.34	459 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-17)	F	3.31	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-18)	F	3.29	532 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-19)	F	3.36	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-20)	F	3.42	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-21)	F	3.42	608 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-22)	F	3.00	350 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-23)	F	3.27	406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-24)	F	3.25	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-25)	F	3.23	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-26)	F	3.31	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 5C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H5-27)	F	3.38	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-28)	F	3.38	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-29)	F	3.31	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-30)	F	3.61	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-31)	F	3.57	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-32)	F	3.51	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-33)	F	3.61	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-34)	F	3.66	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-35)	F	3.62	645 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-36)	F	3.07	364 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-37)	F	3.36	420 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-38)	F	3.33	454 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-39)	F	3.29	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-40)	F	3.38	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-41)	F	3.44	512 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-42)	F	3.44	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-43)	F	2.81	302 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-44)	F	3.11	358 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-45)	F	3.09	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-46)	F	3.09	431 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-47)	F	3.18	422 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-48)	F	3.22	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-49)	F	3.25	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-50)	F	3.03	388 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-51)	F	3.33	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-52)	F	3.29	478 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 5C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H5-53)	F	3.27	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-54)	F	3.36	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-55)	F	3.42	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-56)	F	3.42	593 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-57)	F	3.05	475 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-58)	A	3.07	509 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H5-59)	F	3.11	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-60)	F	3.11	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-61)	F	3.18	566 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H5-62)	F	3.46	624 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 6C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H6-1)	C	14.10	410 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-2)	D	15.20	530 (M + H) ⁺ , 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-3)	D	12.60	414 (M + H) ⁺ , 264.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-4)	C	15.40	470 (M + H) ⁺ , 215.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-5)	D	15.00	504 (M + H) ⁺ , 354.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-6)	D	14.60	543 (M + H) ⁺ , 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-7)	D	15.30	534 (M + H) ⁺ , 426, 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-8)	D	15.30	562 (M + H) ⁺ , 224.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-9)	D	15.50	619 (M + H) ⁺ , 511, 281.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-10)	F	3.38	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-11)	F	3.59	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-12)	C	16.50	563 (M + H) ⁺ , 144.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-13)	F	3.55	602 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-14)	D	15.80	593 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-15)	F	3.64	621 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-16)	F	3.65	678 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-17)	C	14.90	420 (M + H) ⁺ , 270.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-18)	F	3.55	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-19)	F	3.55	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-20)	C	15.80	549 (M + H) ⁺ , 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-21)	D	15.70	540 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-22)	F	3.62	568 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-23)	F	3.62	625 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-24)	F	3.55	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-25)	F	3.79	566 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-26)	F	3.78	600 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 6C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H6-27)	F	3.74	639 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-28)	D	17.20	630 (M + H) ⁺ , 480, 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-29)	F	3.84	658 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-30)	F	3.80	715 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-31)	C	15.50	434 (M + H) ⁺ , 284.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-32)	F	3.60	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-33)	F	3.60	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-34)	F	3.56	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-35)	C	17.20	554 (M + H) ⁺ , 446.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-36)	F	3.67	582 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-37)	F	3.67	639 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-38)	F	3.22	372 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-39)	D	14.30	428 (M + H) ⁺ , 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-40)	F	3.44	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-41)	F	3.42	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-42)	D	15.20	492 (M + H) ⁺ , 384, 279	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-43)	C	16.20	520 (M + H) ⁺ , 224.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-44)	C	16.40	577 (M + H) ⁺ , 469, 281.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-45)	F	3.36	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-46)	F	3.60	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-47)	F	3.59	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-48)	F	3.57	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-49)	D	16.20	578 (M + H) ⁺ , 522.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-50)	C	17.20	606 (M + H) ⁺ , 550.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-51)	F	3.66	663 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-52)	F	3.16	489 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 6C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H6-53)	F	3.33	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-54)	C	15.20 15.70	579 (M + H) ⁺ , 420, 158.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-55)	F	3.33	618 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-56)	C	15.60 16.00	609 (M + H) ⁺ , 501, 279, 158.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H6-57)	F	3.40	637 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H6-58)	F	3.44	694 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 7C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H7-1)	C	15.20	424 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-2)	D	14.90	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-3)	F	3.57	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-4)	F	3.55	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-5)	C	17.10	544 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-6)	C	15.20	428 (M + H) ⁺ , 264.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-7)	D	15.00	484 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-8)	F	3.51	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-9)	F	3.49	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-10)	F	3.56	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-11)	C	17.20	576 (M + H) ⁺ , 197.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-12)	F	3.59	633 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-13)	C	16.20	487 (M + H) ⁺ , 279.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-14)	D	15.70	543 (M + H) ⁺ , 274.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-15)	F	3.64	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-16)	F	3.62	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-17)	F	3.68	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-18)	F	3.72	635 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-19)	C	17.70	692 (M + H) ⁺ , 584.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-20)	C	15.60	434 (M + H) ⁺ , 270.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-21)	C	17.20	490 (M + H) ⁺ , 326, 221.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-22)	C	17.20	524 (M + H) ⁺ , 360, 255.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-23)	C	16.90	563 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-24)	C	17.50	554 (M + H) ⁺ , 285.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-25)	C	17.70	582 (M + H) ⁺ , 313, 149.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-26)	C	17.70	639 (M + H) ⁺ , 531, 370, 213.	APCI (Pos., 40 V)

表 7C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H7-27)	C	17.70	524 (M + H) ⁺ , 360, 255, 181.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-28)	D	17.10	580 (M + H) ⁺ , 416, 181.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-29)	F	3.86	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-30)	F	3.80	653 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-31)	C	19.00	644 (M + H) ⁺ , 149.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-32)	F	3.91	672 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-33)	F	3.87	729 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-34)	D	16.10	504 (M + H) ⁺ , 235.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-35)	F	3.67	538 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-36)	F	3.66	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-37)	F	3.73	568 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-38)	F	3.76	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-39)	F	3.72	653 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-40)	C	15.20	386 (M + H) ⁺ , 222.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-41)	D	14.90	442 (M + H) ⁺ , 278.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-42)	D	15.20	476 (M + H) ⁺ , 312.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-43)	C	16.40	515 (M + H) ⁺ , 488, 404, 351, 256, 220, 146, 130.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-44)	D	15.50	506 (M + H) ⁺ , 398.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-45)	D	15.50	534 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-46)	D	15.80	591 (M + H) ⁺ , 483.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-47)	C	16.60	472 (M + H) ⁺ , 416, 279	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-48)	C	17.40	528 (M + H) ⁺ , 499, 473, 452, 415, 247, 203, 149.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-49)	F	3.69	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-50)	F	3.66	601 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-51)	F	3.71	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 7C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H7-52)	F	3.74	620 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-53)	F	3.75	677 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-54)	C	14.70	503 (M + H) ⁺ , 344.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-55)	D	14.20	559 (M + H) ⁺ , 400, 279, 158.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H7-56)	F	3.39	593 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-57)	F	3.39	632 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-58)	F	3.46	623 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-59)	F	3.48	651 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H7-60)	F	3.51	708 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 8C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H8-1)	C	10.70	368 (M + H) ⁺ , 250.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-2)	F	2.98	407 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-3)	F	0.67	282 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-4)	C	9.60 10.30	338 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-5)	F	2.90	372 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-6)	F	2.92	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-7)	F	2.98	402 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-8)	F	3.03	452 (M + Na) ⁺ , 430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-9)	F	3.09	509 (M + Na) ⁺ , 487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-10)	C	9.20	341 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-11)	F	3.14	397 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-12)	F	3.12	431 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-13)	F	3.12	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-14)	F	3.18	461 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-15)	F	3.23	489 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-16)	F	3.27	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-17)	F	2.63	288 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-18)	C	12.00	344 (M + H) ⁺ , 215, 124.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-19)	F	3.01	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-20)	F	3.03	417 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-21)	F	3.10	408 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-22)	F	3.16	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-23)	F	3.20	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-24)	F	3.07	378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-25)	F	3.34	434 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 8C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H8-26)	C	16.00	468 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-27)	F	3.33	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-28)	F	3.38	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-29)	F	3.44	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-30)	F	3.42	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-31)	C	8.90	302 (M + H) ⁺ , 123.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-32)	F	3.12	358 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-33)	F	3.11	392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-34)	C	13.40	431 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-35)	F	3.18	422 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-36)	F	3.23	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-37)	F	3.23	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-38)	F	0.65	240 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-39)	D	8.60	296 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-40)	F	2.87	330 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-41)	F	2.89	369 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-42)	F	2.94	360 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-43)	F	3.01	388 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-44)	F	3.07	445 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-45)	F	2.79	326 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-46)	F	3.09	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-47)	F	3.11	455 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-48)	F	3.16	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-49)	C	14.60	474 (M + H) ⁺ , 418.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H8-50)	F	3.23	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-51)	F	1.95	357 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 8C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H8-52)	F	3.01	413 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-53)	F	3.00	447 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-54)	F	3.03	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-55)	F	3.07	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-56)	F	3.12	505 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H8-57)	C	12.50	562 (M + H) ⁺ , 454.	APCI (Pos., 40 V)

表 9C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H9-1)	D	12.30	533 (M + H) ⁺ , 388.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-2)	D	13.36	547 (M + H) ⁺ , 439, 181.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-3)	D	16.15	629 (M + H) ⁺ , 521.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-4)	D	13.78	561 (M + H) ⁺ ,	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-5)	D	14.20	575 (M + H) ⁺ , 460.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-6)	D	14.90	589 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-7)	D	11.36	604 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-8)	D	11.26	604 (M + H) ⁺ , 496.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-9)	D	13.90	609 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-10)	D	14.40	589 (M + H) ⁺ , 474.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-11)	D	13.52	589 (M + H) ⁺ , 481.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-12)	D	11.05	606 (M + H) ⁺ , 498.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-13)	D	11.06	620 (M + H) ⁺ , 512.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-14)	D	11.31	598 (M + H) ⁺ , 490.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-15)	D	11.05	584 (M + H) ⁺ , 476.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-16)	D	10.99	584 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-17)	D	13.62	648 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-18)	D	11.68	604 (M + H) ⁺ , 496.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-19)	D	14.41	597 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-20)	D	12.89	535 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-21)	D	14.41	577 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-22)	D	14.05	625 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-23)	D	13.68	549 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-24)	D	14.05	563 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-25)	D	13.73	601 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-26)	D	13.89	613 (M + H) ⁺ , 505.	APCI (Pos., 40 V)

表 9C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H9-27)	D	13.99	601 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-28)	D	13.89	613 (M + H) ⁺ , 505.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-29)	D	14.05	601 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-30)	D	13.73	613 (M + H) ⁺ , 505.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-31)	D	14.41	597 (M + H) ⁺ , 489.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-32)	D	14.31	563 (M + H) ⁺ , 455.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-33)	D	14.68 14.95	611 (M + H) ⁺ , 503.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-34)	D	13.57	549 (M + H) ⁺ , 441.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-35)	D	14.20	563 (M + H) ⁺ , 455.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-36)	D	13.84	583 (M + H) ⁺ , 475.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-37)	D	11.10	564 (M + H) ⁺ , 456.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-38)	D	12.35	551 (M + H) ⁺ , 443.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-39)	D	12.04	531 (M + H) ⁺ , 423.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-40)	D	12.56	533 (M + H) ⁺ , 425.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-41)	D	11.78	551 (M + H) ⁺ , 443.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-42)	D	14.20	563 (M + H) ⁺ , 455.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-43)	D	12.99	535 (M + H) ⁺ , 427.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-44)	D	11.21	578 (M + H) ⁺ , 470.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-45)	D	13.20	579 (M + H) ⁺ , 471.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-46)	D	14.83	611 (M + H) ⁺ , 503.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-47)	D	15.31	625 (M + H) ⁺ , 517.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-48)	D	14.36	563 (M + H) ⁺ , 563.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-49)	D	11.04	601 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-50)	D	13.56	549 (M + H) ⁺ , 441.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-51)	D	15.26	601 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)

表 9C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H9-52)	D	13.15	547 (M + H) ⁺ , 439.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-53)	D	12.19	521 (M + H) ⁺ , 413.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-54)	D	12.63	565 (M + H) ⁺ , 457.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-55)	D	11.00	598 (M + H) ⁺ , 493.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-56)	D	14.57	617 (M + H) ⁺ , 509.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-57)	D	13.36	581 (M + H) ⁺ , 473.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-58)	D	13.98	603 (M + H) ⁺ , 495.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-59)	D	14.57	609 (M + H) ⁺ , 501.	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-60)	D	14.05	607 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-61)	D	13.68	587 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H9-62)	D	11.21	598 (M + H) ⁺ , 490.	APCI (Pos., 40 V)

表 10C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H10-1)	F	3.39	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-2)	F	3.47	532 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-3)	F	3.79	615 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-4)	F	3.49	547 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-5)	F	3.55	561 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-6)	F	3.62	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-7)	F	3.64	589 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-8)	F	3.22	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-9)	F	3.22	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-10)	F	3.58	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-11)	F	3.58	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-12)	F	3.49	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-13)	F	3.20	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-14)	F	3.20	606 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-15)	F	3.20	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-16)	F	3.18	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-17)	F	3.18	570 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-18)	F	3.45	634 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-19)	F	3.23	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-20)	F	3.44	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-21)	F	3.57	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-22)	F	3.40	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-23)	F	3.58	563 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-24)	F	3.66	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-25)	F	3.47	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-26)	D	13.62	549 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 10C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H10-27)	F	3.55	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-28)	F	3.53	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-29)	F	3.53	599 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-30)	F	3.55	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-31)	F	3.53	599 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-32)	F	3.55	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-33)	F	3.53	599 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-34)	F	3.58	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-35)	F	3.56	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-36)	F	3.60	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-37)	F	3.45	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-38)	F	3.53	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-39)	F	3.51	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-40)	F	3.18	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-41)	F	3.34	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-42)	F	3.36	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-43)	F	3.40	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-44)	F	3.27	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-45)	F	3.53	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-46)	F	3.40	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-47)	F	3.18	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-48)	F	3.40	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-49)	F	3.60	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-50)	F	3.67	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-51)	F	3.53	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-52)	F	3.18	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 10C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H10-53)	F	3.47	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-54)	F	3.64	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-55)	F	3.44	533 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-56)	F	3.34	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-57)	F	3.36	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-58)	F	3.45	640 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-59)	F	3.18	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-60)	F	3.60	603 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-61)	F	3.45	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-62)	F	3.53	589 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-63)	F	3.60	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-64)	F	3.53	593 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-65)	F	3.29	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-66)	F	3.49	573 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-67)	F	3.60	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H10-68)	F	3.20	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 11C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H11-1)	D	12.10	412 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-2)	D	13.52	426 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-3)	D	16.47	508 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-4)	D	14.03	440 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-5)	D	14.36	454 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-6)	D	15.15	468 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-7)	D	10.66	483 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-8)	D	10.52	483 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-9)	D	13.94	488 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-10)	D	15.02	468 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-11)	D	13.36	468 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-12)	D	10.31	485 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-13)	D	10.52	499 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-14)	D	10.73	477 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-15)	D	10.36	463 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-16)	D	10.26	463 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-17)	D	13.76	527 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-18)	D	10.89	483 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-19)	D	13.92	476 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-20)	D	12.78	414 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-21)	D	13.47	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-22)	D	13.84	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-23)	D	13.84	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-24)	D	13.84	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-25)	D	14.05	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-26)	D	13.57	492 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 11C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H11-27)	D	14.52	476 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-28)	D	14.41	442 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-29)	D	14.92 15.50	490 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-30)	D	13.62	428 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-31)	D	14.36	442 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-32)	D	13.78	462 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-33)	D	10.31	443 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-34)	D	12.10	430 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-35)	D	11.63	410 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-36)	D	12.42	412 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-37)	D	11.31	430 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-38)	D	14.26	442 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-39)	D	12.89	414 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-40)	D	10.52	457 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-41)	D	13.10	458 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-42)	D	15.04	490 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-43)	D	15.57	504 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-44)	D	14.57	442 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-45)	D	10.52	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-46)	D	13.73	428 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-47)	D	15.47	480 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-48)	D	13.10	426 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-49)	D	11.94	400 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-50)	D	12.36	444 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-51)	D	10.63	477 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 11C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H11-52)	D	14.57	496 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-53)	D	13.15	460 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-54)	D	13.99	482 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-55)	D	14.73	488 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-56)	D	14.05	486 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-57)	D	13.68	466 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
19 (H11-58)	D	10.73	477 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 12C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H12-1)	F	3.45	426 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-2)	F	3.56	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-3)	F	3.93	522 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-4)	F	3.60	454 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-5)	F	3.66	468 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-6)	F	3.75	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-7)	F	3.71	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-8)	F	3.77	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-9)	F	3.25	497 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-10)	F	3.27	497 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-11)	F	3.67	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-12)	F	3.69	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-13)	F	3.60	482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-14)	F	3.23	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-15)	F	3.23	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-16)	F	3.23	491 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-17)	F	3.22	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-18)	F	3.22	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-19)	F	3.27	497 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-20)	F	3.49	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-21)	F	3.64	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-22)	F	3.49	428 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-23)	F	3.69	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-24)	F	3.77	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-25)	F	3.54	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-26)	F	3.62	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 12C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H12-27)	F	3.64	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-28)	F	3.62	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-29)	F	3.62	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-30)	F	3.62	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-31)	F	3.61	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-32)	F	3.64	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-33)	F	3.60	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-34)	F	3.66	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-35)	F	3.64	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-36)	F	3.71	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-37)	F	3.57	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-38)	F	3.63	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-39)	F	3.60	476 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-40)	F	3.19	457 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-41)	F	3.42	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-42)	F	3.43	424 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-43)	F	3.45	426 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-44)	F	3.32	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-45)	F	3.62	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-46)	F	3.49	428 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-47)	F	3.20	471 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-48)	F	3.49	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-49)	F	3.70	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-50)	F	3.77	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-51)	F	3.62	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-52)	F	3.21	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 12C-4

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H12-53)	F	3.56	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-54)	F	3.75	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-55)	F	3.51	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-56)	F	3.40	414 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-57)	F	3.75	484 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-58)	F	3.42	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-59)	F	3.20	491 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-60)	F	3.68	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-61)	F	3.52	474 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-62)	F	3.62	496 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-63)	F	3.67	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-64)	F	3.60	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-65)	F	3.33	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-66)	F	3.33	444 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-67)	F	3.57	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-68)	F	3.68	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H12-69)	F	3.20	491 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 13C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H13-1)	F	3.48	440 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-2)	F	3.60	454 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-3)	F	3.94	536 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-4)	F	3.64	468 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-5)	F	3.69	482 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-6)	F	3.78	496 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-7)	F	3.74	530 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-8)	F	3.79	510 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-9)	F	3.29	511 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-10)	F	3.32	511 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-11)	F	3.72	516 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-12)	F	3.73	496 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-13)	F	3.64	496 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-14)	F	3.26	513 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-15)	F	3.28	527 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-16)	F	3.28	505 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-17)	F	3.27	491 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-18)	F	3.58	555 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-19)	F	3.32	511 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-20)	F	3.66	504 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-21)	F	3.66	470 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-22)	F	3.74	484 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-23)	F	3.67	470 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-24)	F	3.66	508 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-25)	F	3.67	520 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-26)	F	3.69	508 (M + H) ⁺	ESI (Pos., 20 V)

表 13C-2

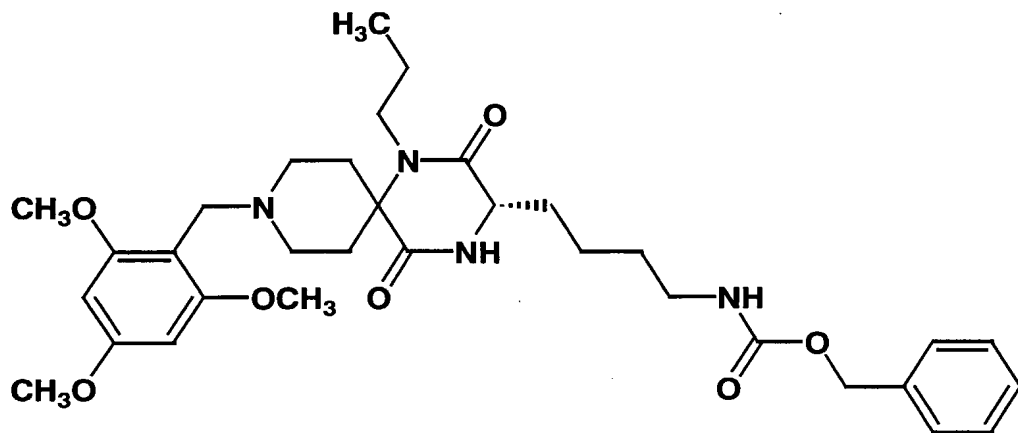
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H13-27)	F	3.64	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-28)	F	3.68	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-29)	F	3.64	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-30)	F	3.72	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-31)	F	3.70	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-32)	F	3.76	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-33)	F	3.61	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-34)	F	3.68	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-35)	F	3.65	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-36)	F	3.24	471 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-37)	F	3.47	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-38)	F	3.51	438 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-39)	F	3.51	440 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-40)	F	3.39	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-41)	F	3.67	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-42)	F	3.54	442 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-43)	F	3.25	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-44)	F	3.55	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-45)	F	3.75	518 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-46)	F	3.80	532 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-47)	F	3.69	470 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-48)	F	3.25	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-49)	F	3.62	456 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-50)	F	3.80	508 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-51)	F	3.58	454 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-52)	F	3.46	428 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 13C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
19 (H13-53)	F	3.80	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-54)	F	3.47	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-55)	F	3.26	505 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-56)	F	3.73	524 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-57)	F	3.58	488 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-58)	F	3.67	510 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-59)	F	3.73	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-60)	F	3.64	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-61)	F	3.62	494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
19 (H13-62)	F	3.25	505 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

実施例 20

(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2,4,6-トリメトキシベンジル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



5

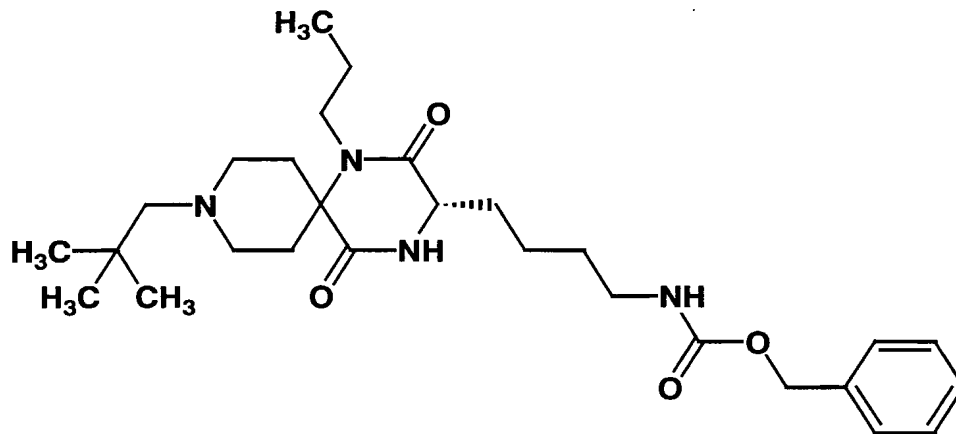
実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) のジクロロエタン (0.2 ml) 溶液に、
2, 4, 6-トリメトキシベンズアルデヒド (0.013 g)、トリアセトキシ水
素化ホウ素ナトリウム (0.015 g)、ジメチルホルムアミド (0.2 ml) を加え
た。反応混合物を室温で 50 時間攪拌した。反応混合物を予めメタノール (3
10 ml) で洗浄したイオン交換樹脂 (OASIS MCX、Waters、60
mg) に吸着させた。メタノール (2 ml) で洗浄し、10% トリエチルア
ミン-メタノール溶液 (2 ml) で溶出した。溶出液を濃縮し、以下の物性
値を有する本発明化合物 (4.4 mg) を得た。

TLC: Rf 0.33 (クロロホルム: メタノール = 10 : 1) ;

15 NMR (CD₃OD): δ 7.33 (m, 5H), 6.21 (s, 2H), 5.05 (s, 2H), 4.00 (m, 1H), 3.80
(s, 9H), 3.59 (s, 2H), 3.40 (m, 2H), 3.11 (t, J = 6.6 Hz, 2H), 3.05-2.75 (m, 4H),
2.40-2.00 (m, 2H), 2.00-1.70 (m, 4H), 1.65-1.25 (m, 6H), 0.90 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 20 (1)

(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2,2-ジメチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



- 5 実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) とピバルアルデヒド ($8 \mu\text{l}$) を用いて、実施例 20 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (2.5 mg) を得た。

TLC : Rf 0.53 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

- 10 NMR (CD_3OD) : δ 7.33 (m, 5H), 5.06 (s, 2H), 4.02 (m, 1H), 3.50-3.30 (m, 2H), 3.20-3.00 (m, 4H), 3.00-2.60 (m, 4H), 2.20-2.00 (m, 2H), 1.90-1.70 (m, 3H), 1.70-1.20 (m, 7H), 0.92 (t, $J = 7.4 \text{ Hz}$, 3H), 0.90 (s, 9H)。

実施例 20 (H14-1) ~ 20 (H15-77)

- 15 実施例 8 または 8 (1) で製造した化合物と相当するアルデヒド誘導体を用いて、実施例 20 と同様の操作をし、以下の表 14A-1 ~ 15A-10 に化合物名を示し、表 14B-1 ~ 15B-12 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 14C-1 ~ 15C-3 に示した。

表 14A-1

実施例番号	化合物名
20 (H14-1)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2,4,6-トリメトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-2)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-シアノフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-3)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-メチルブチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-4)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-(1-カルボキシメチルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-5)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-ジメチルアミノフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-6)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-フェノキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-7)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2E)-2-メチルブテニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 14A-2

実施例番号	化合物名
20 (H14-8)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((1 S, 5 S) - 6, 6 - ジメチルビシクロ [3. 3. 1] - 2 - ヘプテン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-9)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (1 - カルボキシメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-10)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - シクロプロピルメチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-11)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - メチルチオプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-12)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - カルボキシプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-13)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 6 - ジメチル - 5 - ヘプテニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-14)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (キノリン - 2 - イル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-3

実施例番号	化合物名
20 (H14-15)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 S, 3 R, 4 R, 5 R) - 2 - アセチルアミノ - 3, 4, 5, 6 - テトラヒドロキシヘキサニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-16)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2, 2 - ジメチルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-17)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 Z) - デセニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-18)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロピル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-19)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ブチル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-20)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ベンジル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-21)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 E) - 3 - (4 - ジメチルアミノフェニル) プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-4

実施例番号	化合物名
20 (H14-22)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 E) - 3 - (フラン - 2 - イル) プロペニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-23)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - ヒドロキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-24)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - ヒドロキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-25)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - ジヒドロキシボランフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-26)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - ヘプチルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-27)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ベンゾフラン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-28)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - メチルベンゾチオフェン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-5

実施例番号	化合物名
20 (H14-29)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-(4-クロロフェニルチオ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-30)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3,7-ジメチル-6-オクテニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-31)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-32)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-メチル-3-(4-(2,2-ジメチルプロピル)フェニル)プロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-33)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-ベンジルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-34)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-ヒドロキシ-3,5-ビス(1,1-ジメチルエチル)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 14A-6

実施例番号	化合物名
20 (H14-35)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-メチル-3-(4-(1-メチルエチル)フェニル)プロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-36)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3,4-ジ-(ベンジルオキシ)フェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-37)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-オクチルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-38)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3,5,5-トリメチルヘキシル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-39)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ブチルオキシカルボニルメチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-40)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-(4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル)-3-シクロヘキセニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-41)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(5-ヒドロキシペンチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 14A-7

実施例番号	化合物名
20 (H14-42)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - ((1 R, 2 S, 3 R, 5 R) - 2 - ヒドロキシ - 4, 6, 8 - トリオキサスピロ [3. 3. 0] オクタン - 7, 1' - シクロヘキサン) - 3 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-43)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルピラゾール - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-44)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - (1, 1 - ジメチルエチル) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-45)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (1, 4 - ベンゾジオキサン - 6 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-46)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - (2, 2, 6 - トリメチル - 1 - シクロヘキセニル) エチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-47)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - (3 - ジメチルアミノプロピルオキシ) フェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-8

実施例番号	化合物名
20 (H14-48)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(フラン-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-49)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-メチルプロピル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-50)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-シクロヘキシルメチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-51)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(チアゾール-2-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-52)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-アセチルアミノフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-53)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-54)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 14A-9

実施例番号	化合物名
20 (H14-55)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - ビフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-56)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 E, 6 E) - 3, 7 - ジメチル - 2, 6 - オクタジエニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-57)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - ジメチルアミノフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-58)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - エチルヘキシル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-59)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フルオロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-60)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - ヒドロキシエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-61)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ナフタレン - 1 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-10

実施例番号	化合物名
20 (H14-62)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - プロピル - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-63)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 S, 3 S, 4 R) - 2, 3, 4, 5 - テトラヒドロキシペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-64)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (チオフエン - 2 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-65)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 E) - デセニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-66)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - クロロフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-67)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (1, 3 - ベンゾジオキソレン - 4 - イルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-68)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((3 S, 4 R) - 3, 4, 5 - トリヒドロキシペンチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 14A-11

実施例番号	化合物名
20 (H14-69)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2,3-ジメチル-5-オキソ-1-フェニル-3-ピラゾリン-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-70)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-((2E)-4-メチルペンテニル)-3-シクロヘキセニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-71)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-メトキシ-4-ヘキシルオキシフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-72)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-フルオロフェニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-73)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3,5,6-トリメチル-3-シクロヘキセニルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-74)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3,5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
20 (H14-75)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-ベンジルオキシエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 14A-12

実施例番号	化合物名
20 (H14-76)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - メトキシ - 4 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-77)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-78)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - ベンジルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-79)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - フェニルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H14-80)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (4 - アリルオキシフェニルメチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-1

実施例番号	化合物名
20 (H15-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 4, 6-トリメトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-シアノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルブチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(1-カルボキシメチルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ジメチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェノキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2E)-2-メチルブテニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1S, 5S)-6, 6-ジメチルビシクロ [3. 3. 1] -2-ヘプテン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-2

実施例番号	化合物名
20 (H15-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1-カルボキシメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-シクロプロピルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-カルボキシプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 6-ジメチル-5-ヘプテニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(キノリン-2-イル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2S, 3R, 4R, 5R)-2-アセチルアミノ-3, 4, 5, 6-テトラヒドロキシヘキサニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 2-ジメチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4Z)-デセニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-3

実施例番号	化合物名
20 (H15-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェニルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ブチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2E)-3-(フラン-2-イル)プロペニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-ヒドロキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ヒドロキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ジヒドロキシボランフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ヘプチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ベンゾフラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-4

実施例番号	化合物名
20 (H15-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルベンゾチオフェン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(4-クロロフェニルチオ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-29)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 7-ジメチル-6-オクテニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-30)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(ピロリジン-1-イル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-31)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メチル-3-(4-(2, 2-ジメチルプロピル)フェニル)プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-32)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-33)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ヒドロキシ-3, 5-ジ-(1, 1-ジメチルエチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-34)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メチル-3-(4-(1-メチルエチル)フェニル)プロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-5

実施例番号	化合物名
20 (H15-35)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 4-ジ- (ベンジルオキシ) フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-36)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-オクチルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-37)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5, 5-トリメチルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-38)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ブチルオキシカルボニルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-39)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(4-ヒドロキシ-4-メチルペンチル)-3-シクロヘキセニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-40)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(5-ヒドロキシペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-41)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-((1R, 2S, 3R, 5R)-2-ヒドロキシ-4, 6, 8-トリオキサスピロ [ビスクロ [3. 3. 0] オクタン-7, 1'-シクロヘキサン]-3-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-42)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-6

実施例番号	化合物名
20 (H15-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(1, 1-ジメチルエチル)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 4-ベンゾジオキサン-6-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(2, 2, 6-トリメチル-1-シクロヘキセニル)エチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-(3-ジメチルアミノプロピルオキシ)フェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(フラン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メチルプロピル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-シクロヘキシルメチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-50)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(チアゾール-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-7

実施例番号	化合物名
20 (H15-51)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-アセチルアミノフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-52)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-53)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-54)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ビフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-55)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-エチルヘキシル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-56)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-フルオロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-57)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ヒドロキシエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-58)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ナフタレン-1-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-59)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-プロピル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 15A-8

実施例番号	化合物名
20 (H15-60)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2S, 3S, 4R)-2, 3, 4, 5-テトラヒドロキシペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-61)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(チオフエン-2-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-62)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2E)-デセニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-63)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-クロロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-64)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(1, 3-ベンゾジオキソレン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-65)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3S, 4R)-3, 4, 5-トリヒドロキシペンチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-66)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 3-ジメチル-5-オキソ-1-フェニル-3-ピラゾリン-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-67)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-((2E)-4-メチルペンテニル)-3-シクロヘキセニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

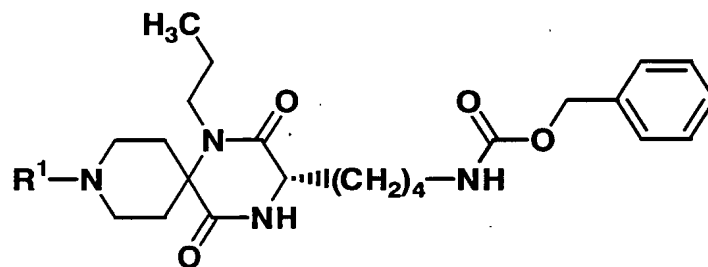
表 15A-9

実施例番号	化合物名
20 (H15-68)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メトキシ-4-ヘキシルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-69)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フルオロフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-70)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5, 6-トリメチル-3-シクロヘキセニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-71)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 5-ジメチル-1-フェニルピラゾール-4-イルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-72)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ベンジルオキシエチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-73)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メトキシ-4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-74)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
20 (H15-75)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-ベンジルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 15A-10

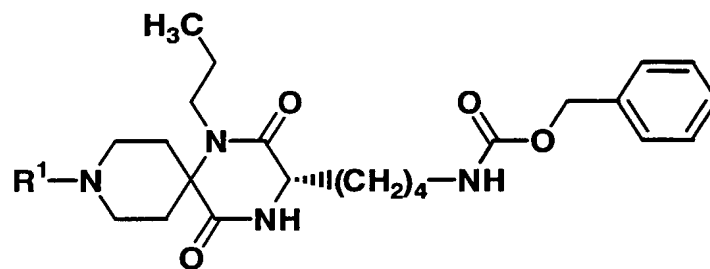
実施例番号	化合物名
20 (H15-76)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェニルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
20 (H15-77)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-アリルオキシフェニルメチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 14B-1



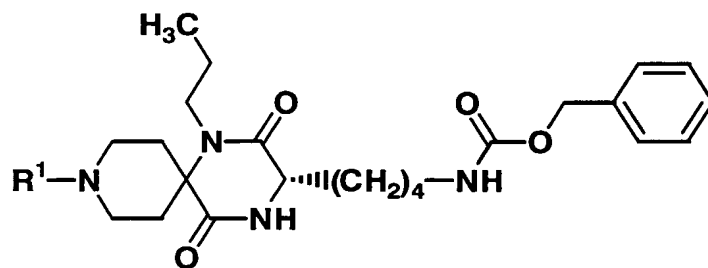
実施例番号	R^1
20 (H14-1)	
20 (H14-2)	
20 (H14-3)	
20 (H14-4)	
20 (H14-5)	
20 (H14-6)	

表 14B-2



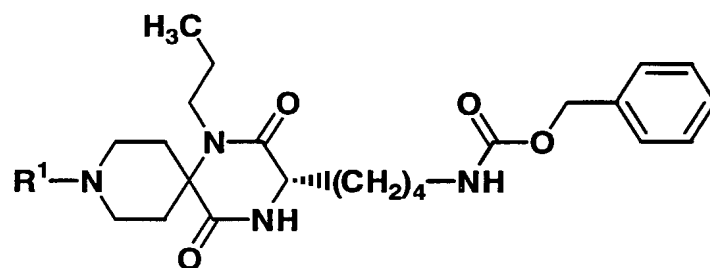
実施例番号	R^1
20 (H14-7)	
20 (H14-8)	
20 (H14-9)	
20 (H14-10)	
20 (H14-11)	
20 (H14-12)	
20 (H14-13)	
20 (H14-14)	

表 14B-3



実施例番号	R ¹
20 (H14-15)	
20 (H14-16)	
20 (H14-17)	
20 (H14-18)	
20 (H14-19)	
20 (H14-20)	
20 (H14-21)	
20 (H14-22)	

表 14B-4



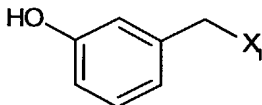
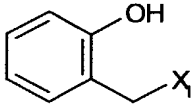
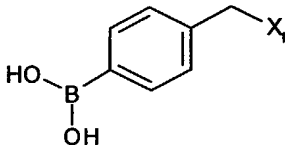
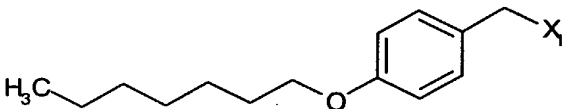
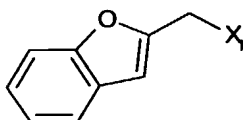
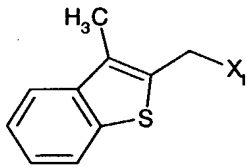
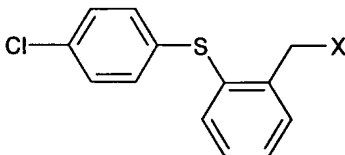
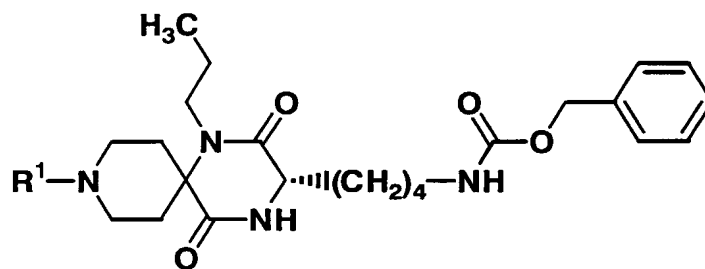
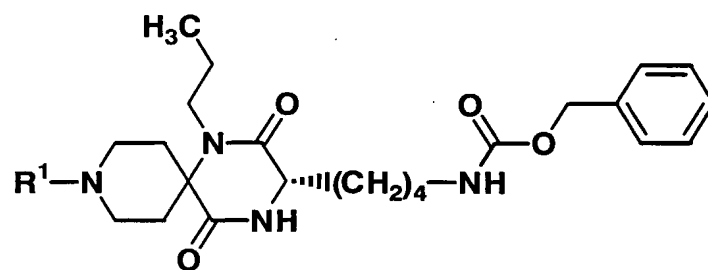
実施例番号	R ¹
20 (H14-23)	
20 (H14-24)	
20 (H14-25)	
20 (H14-26)	
20 (H14-27)	
20 (H14-28)	
20 (H14-29)	

表 14B-5



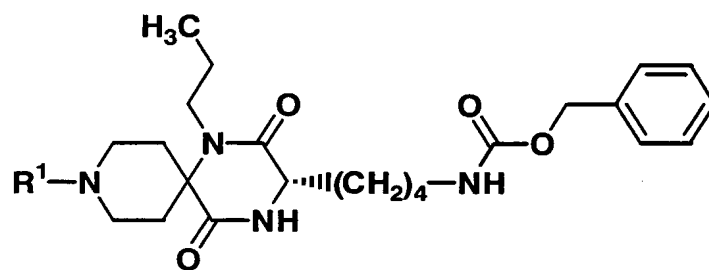
実施例番号	R^1
20 (H14-30)	
20 (H14-31)	
20 (H14-32)	
20 (H14-33)	
20 (H14-34)	
20 (H14-35)	

表 14B-6



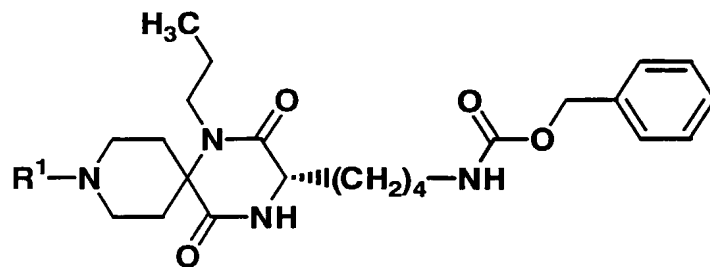
実施例番号	R^1
20 (H14-36)	
20 (H14-37)	
20 (H14-38)	
20 (H14-39)	
20 (H14-40)	
20 (H14-41)	
20 (H14-42)	

表 14B-7



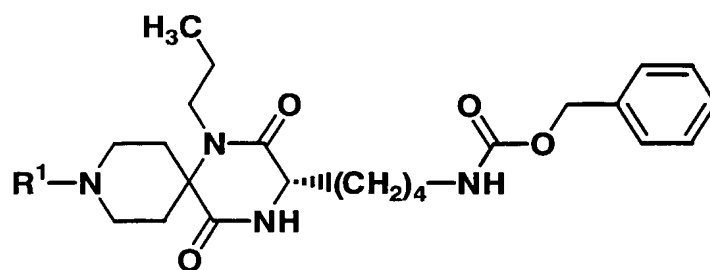
実施例番号	R ¹
20 (H14-43)	
20 (H14-44)	
20 (H14-45)	
20 (H14-46)	
20 (H14-47)	
20 (H14-48)	
20 (H14-49)	

表 14B-8



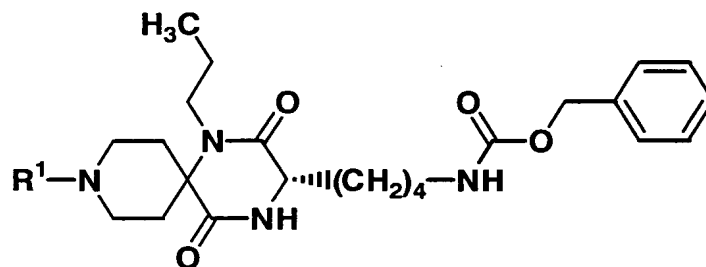
実施例番号	R ¹
20 (H14-50)	
20 (H14-51)	
20 (H14-52)	
20 (H14-53)	
20 (H14-54)	
20 (H14-55)	
20 (H14-56)	
20 (H14-57)	

表 14B-9



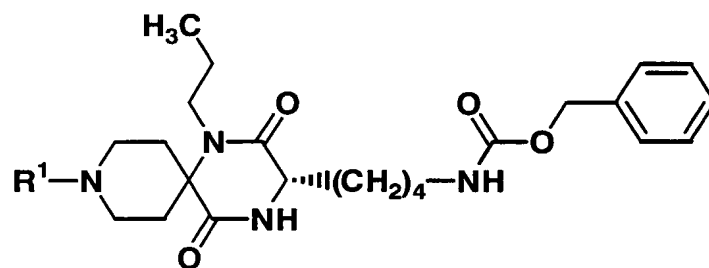
実施例番号	R^1
20 (H14-58)	
20 (H14-59)	
20 (H14-60)	
20 (H14-61)	
20 (H14-62)	
20 (H14-63)	
20 (H14-64)	
20 (H14-65)	
20 (H14-66)	

表 14B-10



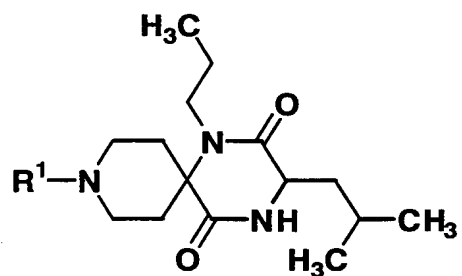
実施例番号	R ¹
20 (H14-67)	
20 (H14-68)	
20 (H14-69)	
20 (H14-70)	
20 (H14-71)	
20 (H14-72)	
20 (H14-73)	

表 14B-11



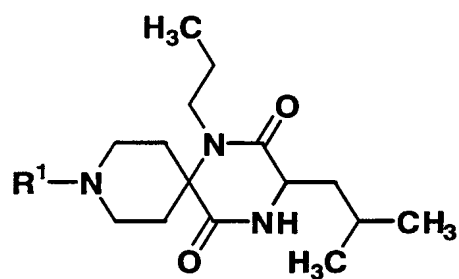
実施例番号	R ¹
20 (H14-74)	
20 (H14-75)	
20 (H14-76)	
20 (H14-77)	
20 (H14-78)	
20 (H14-79)	
20 (H14-80)	

表 15B-1



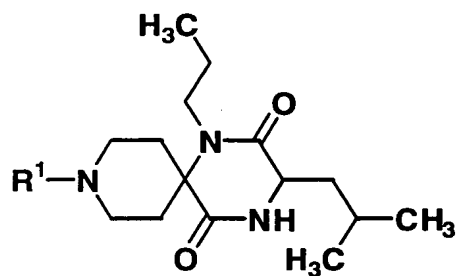
実施例番号	R ¹
20 (H15-1)	
20 (H15-2)	
20 (H15-3)	
20 (H15-4)	
20 (H15-5)	
20 (H15-6)	

表 15B-2



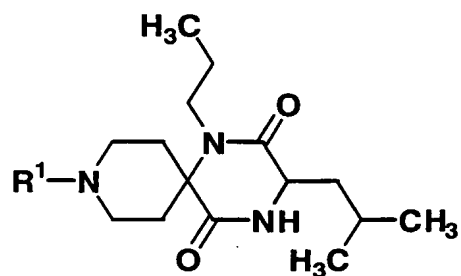
実施例番号	R¹
20 (H15-7)	
20 (H15-8)	
20 (H15-9)	
20 (H15-10)	
20 (H15-11)	
20 (H15-12)	
20 (H15-13)	
20 (H15-14)	

表 15B-3



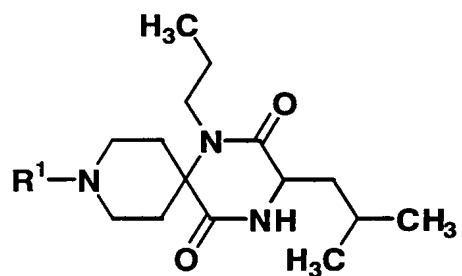
実施例番号	R¹
20 (H15-15)	
20 (H15-16)	
20 (H15-17)	
20 (H15-18)	
20 (H15-19)	
20 (H15-20)	
20 (H15-21)	
20 (H15-22)	

表 15B-4



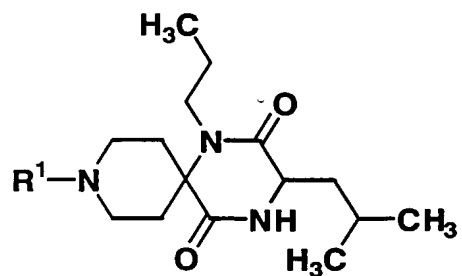
実施例番号	R ¹
20 (H15-23)	
20 (H15-24)	
20 (H15-25)	
20 (H15-26)	
20 (H15-27)	
20 (H15-28)	
20 (H15-29)	

表 15B-5



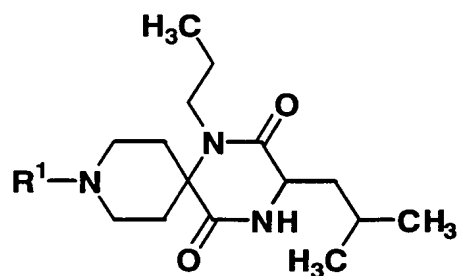
実施例番号	R ¹
20 (H15-30)	
20 (H15-31)	
20 (H15-32)	
20 (H15-33)	
20 (H15-34)	

表 15B-6



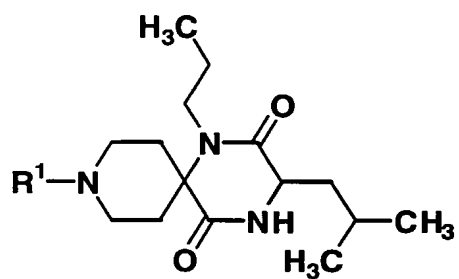
実施例番号	R ¹
20 (H15-35)	
20 (H15-36)	
20 (H15-37)	
20 (H15-38)	
20 (H15-39)	
20 (H15-40)	
20 (H15-41)	

表 15B-7



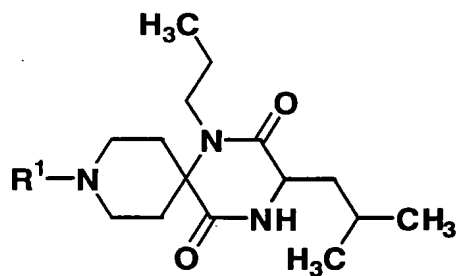
実施例番号	R ¹
20 (H15-42)	
20 (H15-43)	
20 (H15-44)	
20 (H15-45)	
20 (H15-46)	
20 (H15-47)	
20 (H15-48)	

表 15B-8



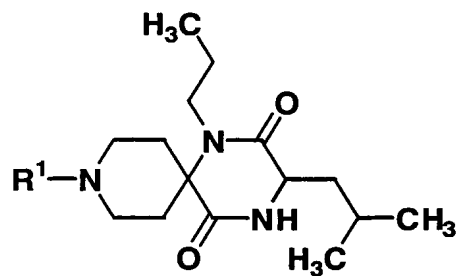
実施例番号	R¹
20 (H15-49)	
20 (H15-50)	
20 (H15-51)	
20 (H15-52)	
20 (H15-53)	
20 (H15-54)	
20 (H15-55)	

表 15B-9



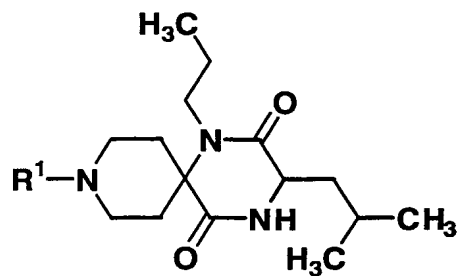
実施例番号	R ¹
20 (H15-56)	
20 (H15-57)	
20 (H15-58)	
20 (H15-59)	
20 (H15-60)	
20 (H15-61)	
20 (H15-62)	
20 (H15-63)	
20 (H15-64)	

表 15B-10



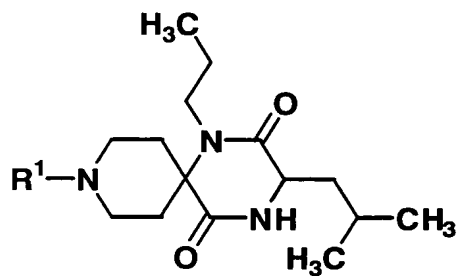
実施例番号	R ¹
20 (H15-65)	
20 (H15-66)	
20 (H15-67)	
20 (H15-68)	
20 (H15-69)	
20 (H15-70)	

表 15B-11



実施例番号	R¹
20 (H15-71)	
20 (H15-72)	
20 (H15-73)	
20 (H15-74)	
20 (H15-75)	
20 (H15-76)	

表 15B-12



実施例番号	R¹
20 (H15-77)	<p>Chemical structure of R¹: A 4-(2-allyloxyphenyl)butyl group with a terminal halogen X. The structure is: H₂C=CH-CH₂-CH₂-O-C₆H₄-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-X, where C₆H₄ is a para-substituted benzene ring.</p>

表 14C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H14-1)	F	3.40	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-2)	F	3.27	546 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-3)	F	3.29	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-4)	F	3.25	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-5)	F	3.12	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-6)	F	3.52	613 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-7)	F	3.25	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-8)	F	3.49	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-9)	F	3.09	489 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-10)	F	3.18	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-11)	F	3.23	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-12)	F	3.12	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-13)	F	3.53	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-14)	F	3.33	572 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-15)	F	3.03	636 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-16)	F	3.25	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-17)	F	3.66	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-18)	F	3.38	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-19)	F	3.22	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-20)	F	3.29	521 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-21)	F	3.11	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-22)	F	3.31	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-23)	F	3.20	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-24)	F	3.23	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-25)	F	3.16	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-26)	F	3.82	635 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 14C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H14-27)	F	3.36	561 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-28)	F	3.44	591 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-29)	F	3.62	663 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-30)	F	3.60	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-31)	F	3.40	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-32)	F	3.67	619 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-33)	F	3.51	627 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-34)	F	3.66	649 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-35)	F	3.64	605 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-36)	F	3.71	733 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-37)	F	3.91	649 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-38)	F	3.56	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-39)	F	3.33	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-40)	F	3.38	625 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-41)	F	3.12	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-42)	F	3.34	643 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-43)	F	3.23	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-44)	F	3.53	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-45)	F	3.31	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-46)	F	3.60	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-47)	F	3.09	622 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-48)	F	3.22	511 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-49)	F	3.20	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-50)	F	3.36	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-51)	F	3.14	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-52)	F	3.16	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 14C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H14-53)	F	3.31	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-54)	F	3.31	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-55)	F	3.51	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-56)	F	3.55	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-57)	F	3.09	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-58)	F	3.51	543 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-59)	F	3.31	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-60)	F	3.07	475 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-61)	F	3.40	571 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-62)	F	3.15	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-63)	F	3.04	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-64)	F	3.25	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-65)	F	3.69	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-66)	F	3.38	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-67)	F	3.29	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-68)	F	3.03	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-69)	F	3.22	631 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-70)	F	3.69	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-71)	F	3.66	651 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-72)	F	3.31	539 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-73)	F	3.50	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-74)	F	3.31	615 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-75)	F	3.35	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-76)	F	3.51	657 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-77)	F	3.55	627 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-78)	F	3.55	627 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 14C-4

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H14-79)	F	3.53	613 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
20 (H14-80)	F	3.42	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 15C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H15-1)	D	12.20	462 (M + H) ⁺ , 282, 181.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-2)	D	10.20	397 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-3)	D	10.50	352 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-4)	D	10.90	446 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-5)	D	9.47	415 (M + H) ⁺ , 282, 150.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-6)	D	13.90	464 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-7)	D	10.50	350 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-8)	D	13.70	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-9)	D	8.05	340 (M + H) ⁺ , 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-10)	D	9.26	336 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-11)	D	9.73	370 (M + H) ⁺ , 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-12)	D	8.36	368 (M + H) ⁺ , 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-13)	D	13.70	406 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-14)	D	12.40	423 (M + H) ⁺ , 158.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-15)	D	7.94	487 (M + H) ⁺ , 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-16)	D	9.94	352 (M + H) ⁺ , 310.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-17)	D	15.10	420 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-18)	D	11.80	400 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-19)	D	9.80	338 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-20)	D	10.80	372 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-21)	D	11.20	388 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-22)	D	10.10	388 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-23)	D	10.70	388 (M + H) ⁺ , 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-24)	D	9.80	416 (M + H) ⁺ , 372, 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-25)	D	16.40	486 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-26)	D	12.30	412 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 15C-2

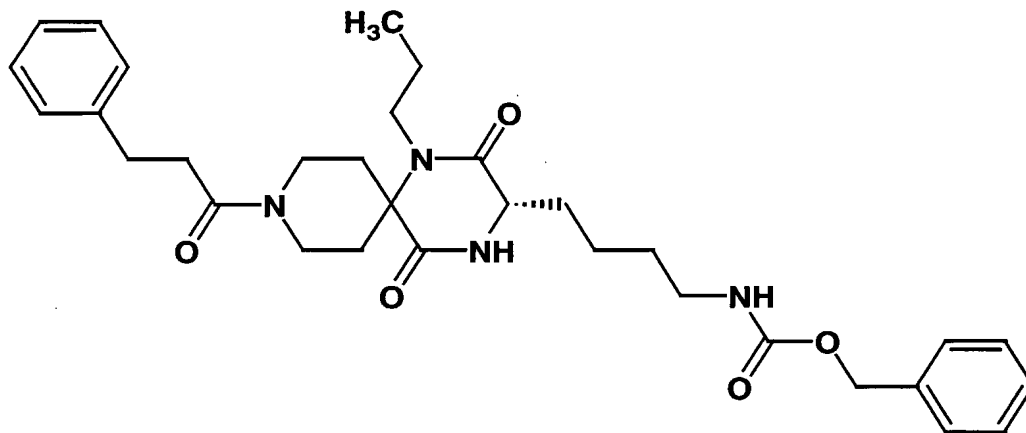
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H15-27)	D	13.20	442 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-28)	D	14.90	514 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-29)	D	14.40	420 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-30)	D	13.20	441 (M + H) ⁺ , 282, 160.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-31)	D	15.40	470 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-32)	D	13.80	478 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-33)	D	15.10	500 (M + H) ⁺ , 282, 219.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-34)	D	14.90	456 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-35)	D	15.60	584 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-36)	D	17.10	500 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-37)	D	14.30	408 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-38)	D	11.60	396 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-39)	D	13.30	476 (M + H) ⁺ , 458.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-40)	D	8.94	368 (M + H) ⁺ , 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-41)	D	13.30	516 (M + Na) ⁺ , 494 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-42)	D	11.10	438 (M + H) ⁺ , 282, 189, 173.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-43)	D	14.40	428 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-44)	D	11.10	430 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-45)	D	14.50	432 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-46)	D	9.21	473 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-47)	D	9.84	362 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-48)	D	9.57	338 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-49)	D	11.70	378 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-50)	D	9.42	379 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-51)	D	10.00	429 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-52)	D	11.40	402 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

表 15C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
20 (H15-53)	D	11.30	402 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-54)	D	14.00	448 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-55)	D	13.50	394 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-56)	D	11.10	390 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-57)	D	8.00	326 (M + H) ⁺ , 296.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-58)	D	12.90	422 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-59)	D	9.05	324 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-60)	D	8.00	414 (M + H) ⁺ , 340, 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-61)	D	10.40	378 (M + H) ⁺ , 310.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-62)	D	15.70	420 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-63)	D	12.30	406 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-64)	D	11.10	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-65)	D	7.79	400 (M + H) ⁺ , 310, 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-66)	D	10.60	482 (M + H) ⁺ , 282.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-67)	D	15.60	458 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-68)	D	15.40	502 (M + H) ⁺ , 137.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-69)	D	11.20	390 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-70)	D	13.60	418 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-71)	D	11.40	466 (M + H) ⁺ , 217.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-72)	D	12.40	416 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-73)	D	13.70	508 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-74)	D	14.20	478 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-75)	D	14.20	478 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-76)	D	13.70	464 (M + H) ⁺ , 205.	APCI (Pos., 40 V)
20 (H15-77)	D	12.60	428 (M + H) ⁺ .	APCI (Pos., 40 V)

実施例 2 1

(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボ
ニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - フェニルプロパノイル) - 1, 4, 9 -
トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



5

実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) のジクロロエタン (0.2m l) 溶液に、
ジイソプロピルエチルアミン (6 μ l)、3 - フェニルプロパノイルクロラ
イド (5 μ l) を加えた。反応混合物を室温で 1 時間攪拌した。反応混合物
をアミノメチル化ポリスチレン - 2 % ジビニルベンゼン共重合樹脂 (N o v
10 a B i o c h e m、A M R e s i n、50 mg) に加え、ジクロロエタン
で洗浄し、ろ過した。ろ液を濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (1
4 mg) を得た。

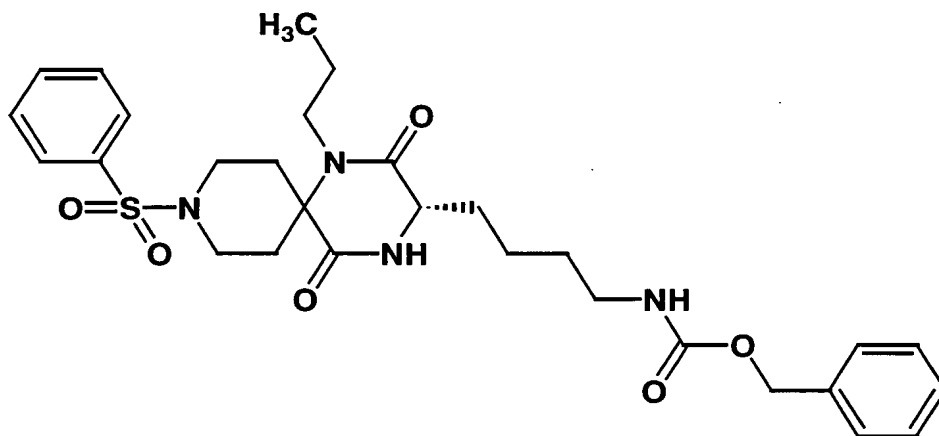
T L C : R f 0.55 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

N M R (CD₃OD) : δ 7.40-7.10 (m, 10H), 5.06 (s, 2H), 4.03 (m, 1H), 3.70-3.55
15 (m, 2H), 3.28-3.00 (m, 5H), 3.00-2.80 (m, 3H), 2.80-2.60 (m, 2H), 2.00-1.65 (m,
6H), 1.65-1.40 (m, 6H), 0.90 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 2 1 (1)

(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボ

ニルアミノ) プチル) - 9 - ベンゼンスルホニル - 1, 4, 9 - トリアザス
ピロ [5. 5] ウンデカン



実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g)、ジイソプロピルエチルアミン (6 μ
5 1) ベンゼンスルホニルクロライド (4.5 μ l) を用いて、実施例 2 1 と同様の
の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (16 mg) を得た。

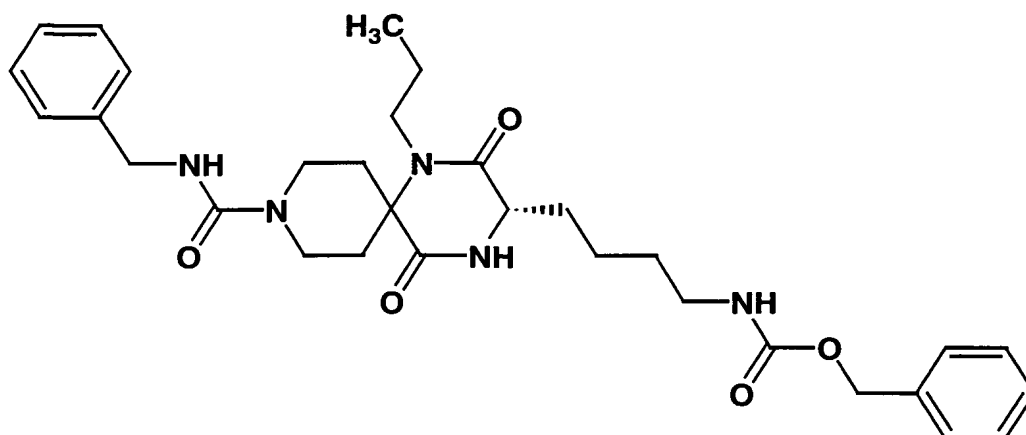
TLC : R_f 0.58 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.80 (m, 2H), 7.63 (m, 3H), 7.33 (m, 5H), 5.04 (s, 2H),
3.98 (t, J = 4.8 Hz, 1H), 3.60-3.35 (m, 2H), 3.28-2.90 (m, 6H), 2.20-1.65 (m, 6H),

10 1.65-1.20 (m, 6H), 0.89 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 2 1 (2)

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルカルボ
ニルアミノ) プチル) - 9 - ベンジルアミノカルボニル - 1, 4, 9 - トリ
15 アザスピロ [5. 5] ウンデカン



実施例 8 で製造した化合物 (0.01 g) とベンジルイソシアネート (4 μ l) を用いて、実施例 2 1 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (16 mg) を得た。

- 5 T L C : R f 0.45 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.10 (m, 10H), 5.05 (s, 2H), 4.37 (s, 2H), 4.10-3.90 (m, 3H), 3.60-3.45 (m, 2H), 3.30-3.00 (m, 4H), 2.10-1.70 (m, 6H), 1.65-1.20 (m, 6H), 0.87 (t, J = 7.4 Hz, 3H)。

10 実施例 2 1 (H 1 6 - 1) ~ 2 1 (H 1 9 - 7 1)

- 実施例 8 または 8 (1) で製造した化合物と相当する酸クロライド誘導体、スルホニルクロライド誘導体またはイソシアネート誘導体を用いて、実施例 2 1、2 1 (1) または 2 1 (2) と同様の操作をし、以下の表 1 6 A - 1 ~ 1 9 A - 9 に化合物名を示し、表 1 6 B - 1 ~ 1 9 B - 1 1 に構造式を示
 15 した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 1 6 C - 1 ~ 1 9 C - 3 に示した。

表 16A-1

実施例番号	化合物名
21 (H16-1)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-フェニルフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-2)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ジメチルアミノフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-3)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-(2-クロロフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-4)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-フルオロフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-5)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-フルオロフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-6)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-フルオロフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-7)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(シクロペンチルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-2

実施例番号	化合物名
21 (H16-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-メチルフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-メトキシフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2,2-ジメチルプロパノイル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(ピリジン-3-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(ピリジン-4-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(ピリジン-2-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-3

実施例番号	化合物名
21 (H16-15)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルオキシアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-16)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-エチル-2,3-ジオキソピペラジニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-17)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-フェニルチオピリジン-3-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-18)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-フェニルオキシピリジン-3-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-19)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-メトキシフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-20)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-(チオフェン-2-イル)アセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-21)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ヘキサノイル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-4

実施例番号	化合物名
21 (H16-22)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - メチルフェニル) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-23)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (2 - メチルプロパノイル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-24)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3 - シクロペンチルプロパノイル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-25)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 E) 3 - フェニル - 2 - プロペノイル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-26)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 - メチルフェニル) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-27)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (3, 3 - ジメチルブテノイル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H16-28)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (シクロヘキシルカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 16A-5

実施例番号	化合物名
21 (H16-29)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(フェニルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-30)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(チオフェン-2-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-31)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,6,6-トリメチル-1-シクロヘキセニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-32)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(エトキシオキザリル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-33)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-34)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((5-メチル-2-フェニル-1,2,3-トリアゾール-4-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-35)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-(3-メトキシフェニル)アセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-6

実施例番号	化合物名
21 (H16-36)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-メトキシフェニルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-37)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((フラン-2-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-38)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-ベンジルオキシアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-39)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(シクロブチルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-40)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-(4-メトキシフェニル)アセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-41)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-アセチル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-42)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(4-メチルペンタノイル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-7

実施例番号	化合物名
21 (H16-43)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-メトキシアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-44)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-メチルチオプロパノイル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-45)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((イソオキサゾール-5-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-46)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-シクロペンチルアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-47)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ペンタノイル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-48)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(3-メチルブタノイル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-49)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルチオアセチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-8

実施例番号	化合物名
21 (H16-50)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-51)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-シアノフェニル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-52)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ブタノイル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-53)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-プロパノイル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-54)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(シクロプロピルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-55)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2H-ベンゾ[3,4-d]1,3-ジオキソラン-5-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-56)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((1-フェニル-5-プロピルピラゾール-4-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-9

実施例番号	化合物名
21 (H16-57)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((5-(1,1-ジメチルエチル)-2-メチルフラン-3-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-58)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((1-(1,1-ジメチルエチル)-3-メチルピラゾール-5-イル)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-59)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-メチルスルホニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-60)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ペンチルスルホニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-61)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((1-メチルエチル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-62)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-クロロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-63)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-ヨードフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-10

実施例番号	化合物名
21 (H16-64)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ニトロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-65)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メチルスルホニルフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-66)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-トリフルオロメチルフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-67)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ビフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-68)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-ビフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-69)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-メトキシカルボニルフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-70)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3,4-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-11

実施例番号	化合物名
21 (H16-71)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,6-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-72)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,5-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-73)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,5-ジメトキシフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-74)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-75)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-ナフチルスルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-76)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(((1E)-2-フェニルビニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H16-77)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((フラン-2-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 16A-12

実施例番号	化合物名
21 (H16-78)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((チオフェン - 2 - イル) スルホニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 17A-1

実施例番号	化合物名
21 (H17-1)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ブromo-2,5-ジクロロチオフェン-3-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-2)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((5-フェニルスルホニルチオフェン-2-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-3)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((7-クロロベンゾフラザン-4-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-4)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メチル-2-アセチルアミノチアゾール-5-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-5)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-メトキシ-ジベンゾフラン-3-イル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-6)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3,4-ジクロロフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-7)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メトキシフェニル)スルホニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-2

実施例番号	化合物名
21 (H17-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-ベンジルスルホニル-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((エチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((プロピルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((1-メチルエチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((エトキシカルボニルメチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((ブチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-クロロフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-3

実施例番号	化合物名
21 (H17-15)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((フェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-16)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-17)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((ヘキシルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-18)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-フルオロフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-19)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((ベンジルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-20)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((シクロヘキシルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-21)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-メチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-4

実施例番号	化合物名
21 (H17-22)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((オクチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-23)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ブロモフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-24)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-(チオフェン-2-イル)エチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-25)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-26)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3-クロロフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-27)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,4,5-トリメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-28)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,4,6-トリメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-5

実施例番号	化合物名
21 (H17-29)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - フェニルオキシフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-30)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - ブチルオキシフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-31)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - フェニルフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-32)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 - フェニルフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-33)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - トリフルオロメチルフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-34)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((3, 4 - ジクロロフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-35)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((4 - ブチルオキシカルボニルフェニルアミノ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 17A-6

実施例番号	化合物名
21 (H17-36)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,6-ジ(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-37)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,5-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-38)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-エチル-6-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-39)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,4,6-トリクロロフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-40)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3,4-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-41)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-メチルチオフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-42)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-メチルチオフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-7

実施例番号	化合物名
21 (H17-43)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((4-ブチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-44)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-45)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,6-ジプロモ-4-エチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-46)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((1-エトキシカルボニル-2-メチルプロピルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-47)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((フェニルカルボニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-48)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,4,6-トリプロモフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-49)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,5-ジフルオロフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-8

実施例番号	化合物名
21 (H17-50)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((3,5-ビス(メトキシカルボニル)フェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-51)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((6,7-メチレンジオキシクマリン-4-イルメチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-52)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2,6-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-53)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-メチルプロピルオキシ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-54)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((2-エチルヘキシルオキシ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-55)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(エトキシカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-56)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(アリルオキシカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-9

実施例番号	化合物名
21 (H17-57)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (プロピルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-58)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ブチルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-59)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ヘキシルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-60)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2, 2, 2 - トリクロロエチルオキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-61)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((フルオレン - 9 - イルメチルオキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-62)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((1 R, 5 R, 2 S) - 5 - メチル - 2 - (1 - メチルエチル) シクロヘキシルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-63)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 - メトキシエトキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 17A-10

実施例番号	化合物名
21 (H17-64)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ペンチルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-65)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((1 - メチルエチルオキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-66)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((3 - ブテニルオキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-67)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((2 R, 1 S, 5 S) - メチル - 2 - (1 - メチルエチル) シクロヘキシルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-68)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (シクロペンチルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-69)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - ((1, 1 - ジメチルエチルオキシ) カルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H17-70)	(3 S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (ベンジルオキシカルボニルアミノ) ブチル) - 9 - (ベンジルオキシカルボニル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 17A-11

実施例番号	化合物名
21 (H17-71)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((N,N-ジフェニルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-72)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((N-フェニル-N-メチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-73)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((N,N-ジメチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-74)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((N,N-ジエチルアミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-75)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-((N,N-ビス(1-メチルエチル)アミノ)カルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-76)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(モルホリン-4-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
21 (H17-77)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(カルバゾール-9-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 17A-12

実施例番号	化合物名
21 (H17-78)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(ピロリジン-1-イルカルボニル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 18A-1

実施例番号	化合物名
21 (H18-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ビフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4, 7, 7-トリメチル-2-オキサ-3-オキソビシクロ[2. 2. 1]ヘプタン-1-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ジメチルアミノフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-(2-クロロフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フルオロフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-フルオロフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-フルオロフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(シクロペンチルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 18A-2

実施例番号	化合物名
21 (H18-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-メチルフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-メトキシフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2, 2-ジメチルプロパノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-3-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピリジン-2-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルオキシアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-エチル-2, 3-ジオキソピペラジニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-フェニルチオピリジン-3-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 18A-3

実施例番号	化合物名
21 (H18-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-フェニルオキシピリジン-3-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メトキシフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(チオフェン-2-イル)アセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ヘキサノイル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチルフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メチルプロパノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-シクロペンチルプロパノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2E)-3-フェニル-2-プロペノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メチルフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 18A-4

実施例番号	化合物名
21 (H18-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3, 3-ジメチルブタノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-シクロヘキシルカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-29)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-フェニルカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-30)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(チオフェン-2-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-31)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 6, 6-トリメチル-1-シクロヘキセニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-32)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((エトキシカルボニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-33)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-34)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((5-メチル-2-フェニル-1, 2, 3-トリアゾール-4-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 18A-5

実施例番号	化合物名
21 (H18-35)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(3-メトキシフェニル)アセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-36)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メトキシフェニルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-37)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((フラン-2-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-38)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ベンジルオキシアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-39)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(シクロブチルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-40)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-(4-メトキシフェニル)アセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-41)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-アセチル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-42)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-メチルペンタノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-メトキシアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 18A-6

実施例番号	化合物名
21 (H18-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルチオプロパノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((イソオキサゾール-5-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-シクロペンチルアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ペンタノイル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(3-メチルプロパノイル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-フェニルチオアセチル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-50)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチル-1, 2, 3-チアジアゾール-5-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-51)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-シアノフェニル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-52)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ブタノイル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 18A-7

実施例番号	化合物名
21 (H18-53)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-プロパノイル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-54)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-シクロプロピルカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-55)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2H-ベンゾ [3, 4-d] 1, 3-ジオキソラン-5-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-56)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-フェニル-5-プロピルピラゾール-4-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-57)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((5-(1, 1-ジメチルエチル)-2-メチルフラン-3-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-58)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-(1, 1-ジメチルエチル)-3-メチルピラゾール-5-イル)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-59)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-メチルスルホニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H18-60)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ペンチルスルホニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 18A-8

実施例番号	化合物名
21 (H18-61)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-メチルエチル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-62)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-ヨードフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-63)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチルスルホニルフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-64)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-トリフルオロメチルフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-65)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェニルフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-66)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-フェニルフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-67)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メトキシカルボニルフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-68)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3, 4-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-69)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 6-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 18A-9

実施例番号	化合物名
21 (H18-70)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 5-ジフルオロフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-71)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 5-ジメトキシフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-72)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(2-ナフチルスルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-73)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(((1E)-2-フェニルビニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-74)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((フラン-2-イル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H18-75)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((チオフェン-2-イル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 19A-1

実施例番号	化合物名
21 (H19-1)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチル-2-アセチルアミノチアゾール-5-イル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-2)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メトキシ-ジベンゾフラン-3-イル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-3)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メトキシフェニル)スルホニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-4)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルスルホニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-5)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((エチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-6)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((プロピルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-7)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-メチルエチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-8)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((エトキシカルボニルメチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 19A-2

実施例番号	化合物名
21 (H19-9)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((ブチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-10)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-クロロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-11)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((フェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-12)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-13)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((ヘキシルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-14)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フルオロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-15)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((ベンジルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-16)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((シクロヘキシルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-17)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-メチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 19A-3

実施例番号	化合物名
21 (H19-18)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((オクチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-19)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ブロモフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-20)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-(チオフエン-2-イル)エチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-21)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-22)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-クロロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-23)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 4, 5-トリメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-24)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 4, 6-トリメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-25)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェニルオキシフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 19A-4

実施例番号	化合物名
21 (H19-26)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ブチルオキシフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-27)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-フェニルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-28)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-フェニルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-29)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-30)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3, 4-ジクロロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-31)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ブチルオキシカルボニルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-32)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 6-ビス(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-33)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 5-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 19A-5

実施例番号	化合物名
21 (H19-34)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-エチル-6-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-35)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 4, 6-トリクロロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-36)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3, 4-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-37)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メチルチオフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-38)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-メチルチオフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-39)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((4-ブチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-40)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 6-ジブromo-4-エチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-41)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-エトキシカルボニル-2-メチルプロピルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 19A-6

実施例番号	化合物名
21 (H19-42)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((フェニルカルボニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-43)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 4, 6-トリプロモフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-44)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 5-ジフルオロフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-45)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3, 5-ビス(メトキシカルボニル)フェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-46)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((6, 7-メチレンジオキシクマリン-4-イルメチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-47)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2, 6-ジメチルフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-48)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メチルプロピルオキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-49)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-エチルヘキシルオキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

表 19A-7

実施例番号	化合物名
21 (H19-50)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-エトキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-51)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-アリルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-52)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-プロピルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-53)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ブチルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-54)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ヘキシルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-55)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((フルオレン-9-イルメチルオキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-56)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1R, 5R, 2S)-5-メチル-2-(1-メチルエチル)シクロヘキシルオキシカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-57)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2-メトキシエトキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン
21 (H19-58)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ペンチルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン

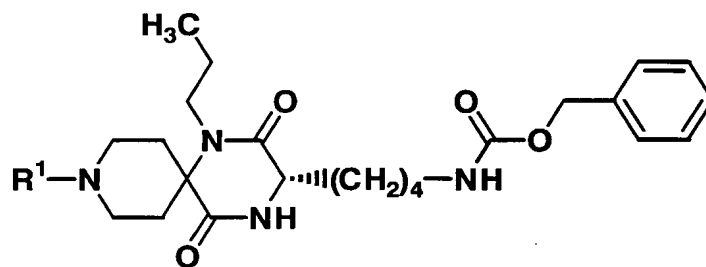
表 19A-8

実施例番号	化合物名
21 (H19-59)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((1-メチルエチルオキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-60)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((3-ブテニルオキシ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-61)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((2R, 1S, 5S)-メチル-2-(1-メチルエチル)シクロヘキシルオキシカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-62)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-シクロペンチルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-63)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-ベンジルオキシカルボニル-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-64)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((N, N-ジフェニルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-65)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((N-フェニル-N-メチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-66)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((N, N-ジメチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-67)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((N, N-ジエチルアミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 19A-9

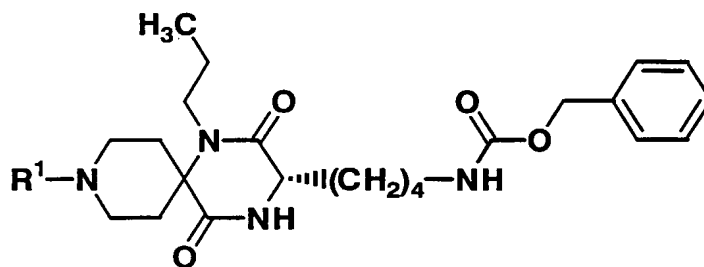
実施例番号	化合物名
21 (H19-68)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-((N, N-ビス(1-メチルエチル)アミノ)カルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-69)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(モルホリン-4-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-70)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(カルバゾール-9-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン
21 (H19-71)	1-プロピル-2, 5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(ピロリジン-1-イルカルボニル)-1, 4, 9-トリアザスピロ[5. 5]ウンデカン

表 16B-1



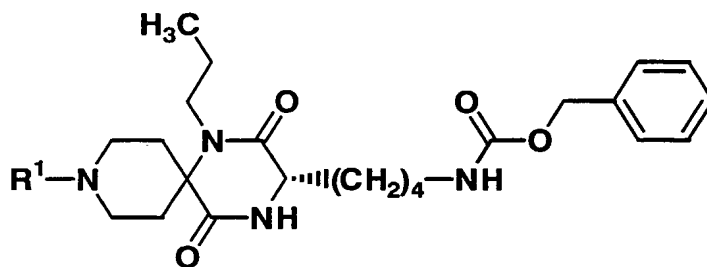
実施例番号	R^1
21 (H16-1)	
21 (H16-2)	
21 (H16-3)	
21 (H16-4)	
21 (H16-5)	

表 16B-2



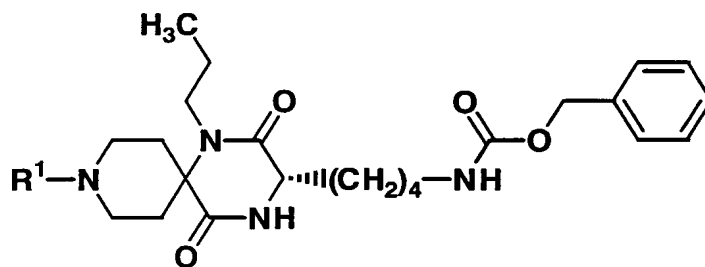
実施例番号	R^1
21 (H16-6)	
21 (H16-7)	
21 (H16-8)	
21 (H16-9)	
21 (H16-10)	
21 (H16-11)	

表 16B-3



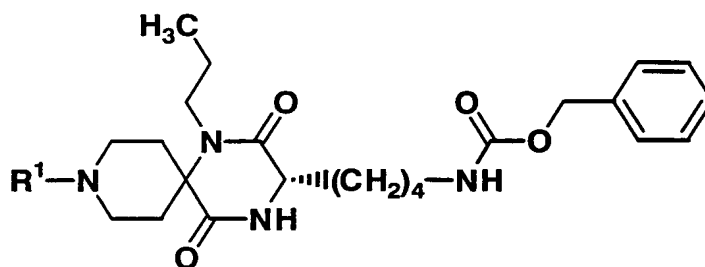
実施例番号	R^1
21 (H16-12)	
21 (H16-13)	
21 (H16-14)	
21 (H16-15)	
21 (H16-16)	
21 (H16-17)	

表 16B-4



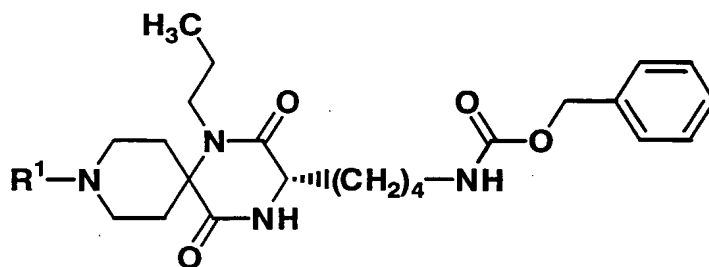
実施例番号	R ¹
21 (H16-18)	
21 (H16-19)	
21 (H16-20)	
21 (H16-21)	
21 (H16-22)	
21 (H16-23)	
21 (H16-24)	

表 16B-5



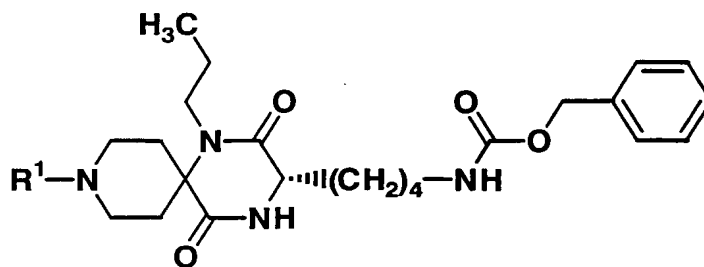
実施例番号	R^1
21 (H16-25)	
21 (H16-26)	
21 (H16-27)	
21 (H16-28)	
21 (H16-29)	
21 (H16-30)	
21 (H16-31)	

表 16B-6



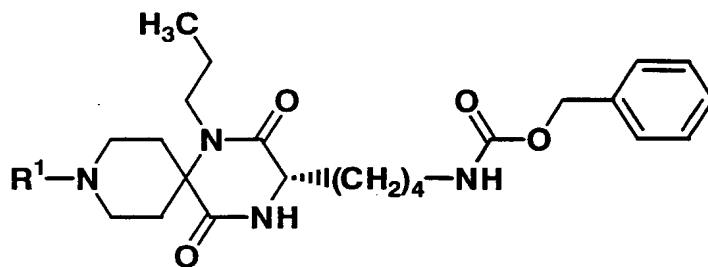
実施例番号	R^1
21 (H16-32)	
21 (H16-33)	
21 (H16-34)	
21 (H16-35)	
21 (H16-36)	
21 (H16-37)	
21 (H16-38)	

表 16B-7



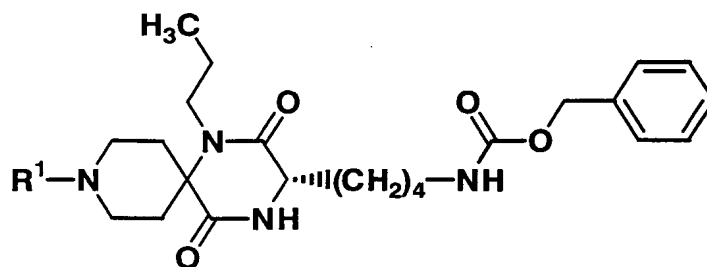
実施例番号	R^1
21 (H16-39)	
21 (H16-40)	
21 (H16-41)	
21 (H16-42)	
21 (H16-43)	
21 (H16-44)	
21 (H16-45)	
21 (H16-46)	

表 16B-8



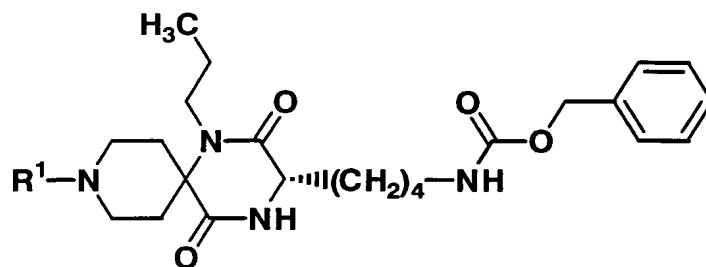
実施例番号	R ¹
21 (H16-47)	
21 (H16-48)	
21 (H16-49)	
21 (H16-50)	
21 (H16-51)	
21 (H16-52)	
21 (H16-53)	
21 (H16-54)	

表 16B-9



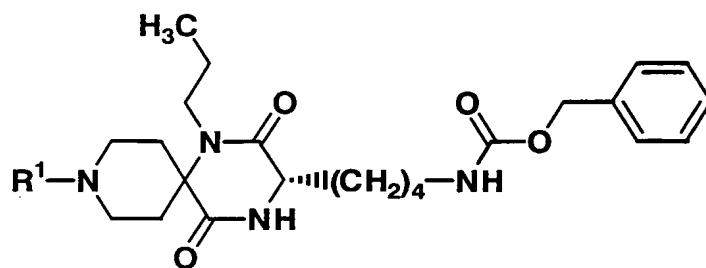
実施例番号	R ¹
21 (H16-55)	
21 (H16-56)	
21 (H16-57)	
21 (H16-58)	
21 (H16-59)	
21 (H16-60)	

表 16B-10



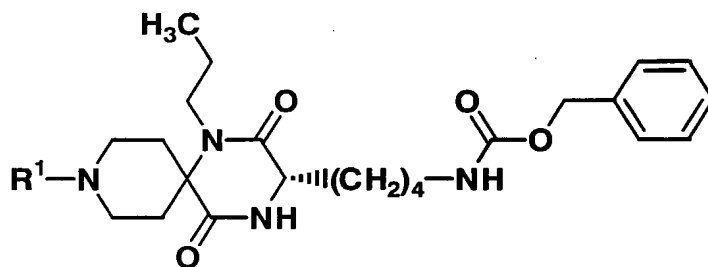
実施例番号	R ¹
21 (H16-61)	
21 (H16-62)	
21 (H16-63)	
21 (H16-64)	
21 (H16-65)	
21 (H16-66)	
21 (H16-67)	
21 (H16-68)	

表 16B-11



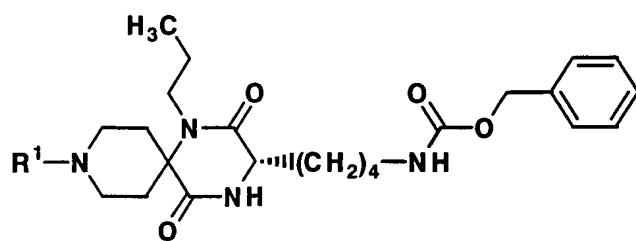
実施例番号	R^1
21 (H16-69)	
21 (H16-70)	
21 (H16-71)	
21 (H16-72)	
21 (H16-73)	
21 (H16-74)	

表 16B-12



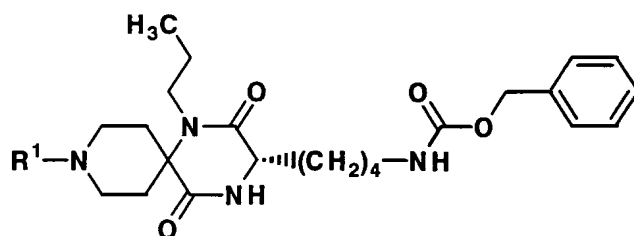
実施例番号	R^1
21 (H16-75)	
21 (H16-76)	
21 (H16-77)	
21 (H16-78)	

表 17B-1



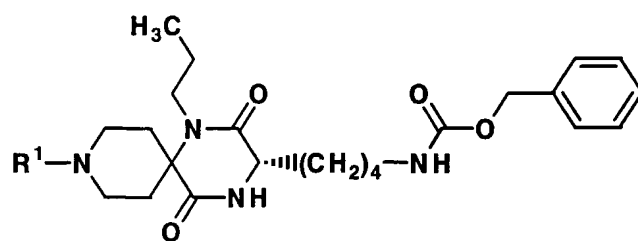
実施例番号	R¹
21 (H17-1)	
21 (H17-2)	
21 (H17-3)	
21 (H17-4)	
21 (H17-5)	
21 (H17-6)	

表 17B-2



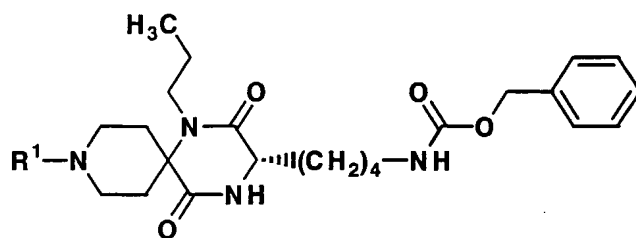
実施例番号	R^1
21 (H17-7)	<chem>COc1ccc(S(=O)(=O)X)cc1</chem>
21 (H17-8)	<chem>c1ccccc1CS(=O)(=O)X</chem>
21 (H17-9)	<chem>CCC(N)C(=O)X</chem>
21 (H17-10)	<chem>CCCC(N)C(=O)X</chem>
21 (H17-11)	<chem>CC(C)C(N)C(=O)X</chem>
21 (H17-12)	<chem>CCOC(=O)CC(N)C(=O)X</chem>
21 (H17-13)	<chem>CCCCC(N)C(=O)X</chem>
21 (H17-14)	<chem>Clc1ccc(NC(=O)X)cc1</chem>

表 17B-3



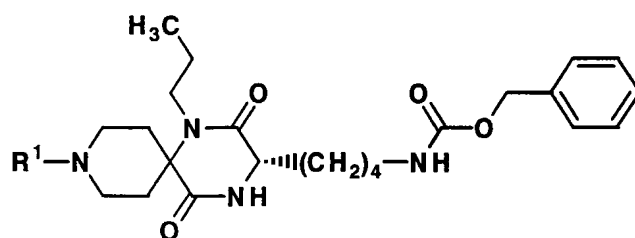
実施例番号	R ¹
21 (H17-15)	
21 (H17-16)	
21 (H17-17)	
21 (H17-18)	
21 (H17-19)	
21 (H17-20)	
21 (H17-21)	

表 17B-4



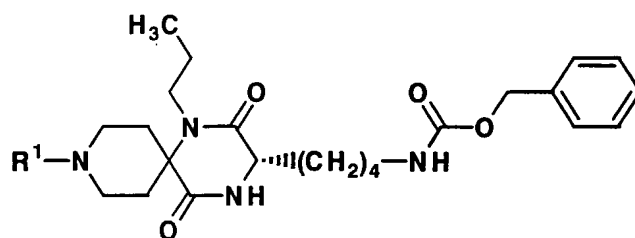
実施例番号	R ¹
21 (H17-22)	
21 (H17-23)	
21 (H17-24)	
21 (H17-25)	
21 (H17-26)	
21 (H17-27)	
21 (H17-28)	

表 17B-5



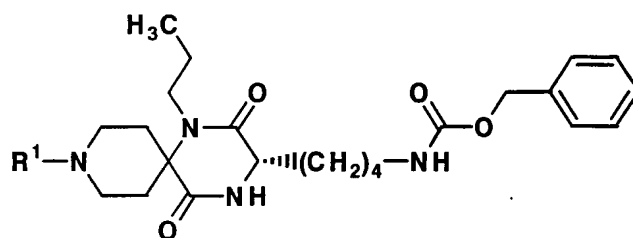
実施例番号	R^1
21 (H17-29)	<chem>O=C(Nc1ccc(Oc2ccccc2)cc1)X</chem>
21 (H17-30)	<chem>O=C(Nc1ccc(OCCCC)cc1)X</chem>
21 (H17-31)	<chem>O=C(Nc1ccc(cc1)-c2ccccc2)X</chem>
21 (H17-32)	<chem>O=C(Nc1ccccc1-c2ccccc2)X</chem>
21 (H17-33)	<chem>O=C(Nc1ccc(C(F)(F)F)cc1)X</chem>
21 (H17-34)	<chem>O=C(Nc1cc(Cl)cc(Cl)c1)X</chem>

表 17B-6



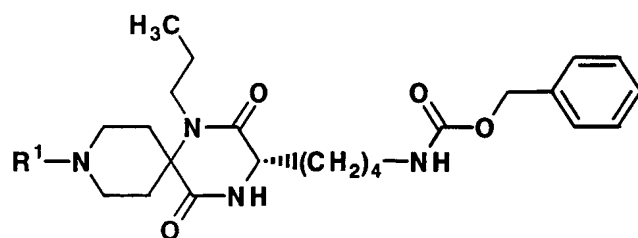
実施例番号	R¹
21 (H17-35)	
21 (H17-36)	
21 (H17-37)	
21 (H17-38)	
21 (H17-39)	

表 17B-7



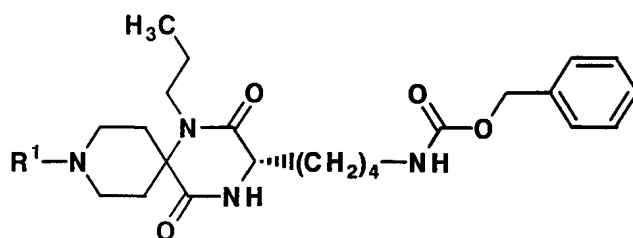
実施例番号	R¹
21 (H17-40)	
21 (H17-41)	
21 (H17-42)	
21 (H17-43)	
21 (H17-44)	
21 (H17-45)	

表 17B-8



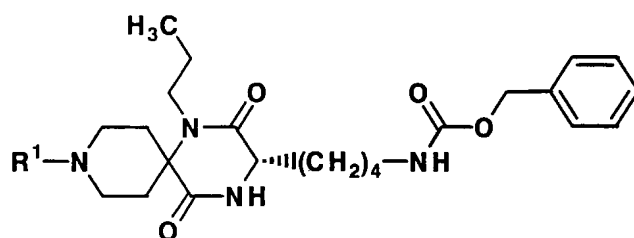
実施例番号	R ¹
21 (H17-46)	
21 (H17-47)	
21 (H17-48)	
21 (H17-49)	
21 (H17-50)	
21 (H17-51)	

表 17B-9



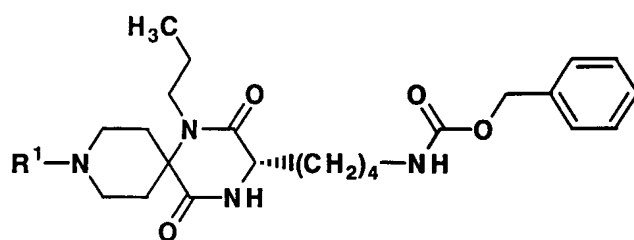
実施例番号	R ¹
21 (H17-52)	
21 (H17-53)	
21 (H17-54)	
21 (H17-55)	
21 (H17-56)	
21 (H17-57)	
21 (H17-58)	
21 (H17-59)	

表 17B-10



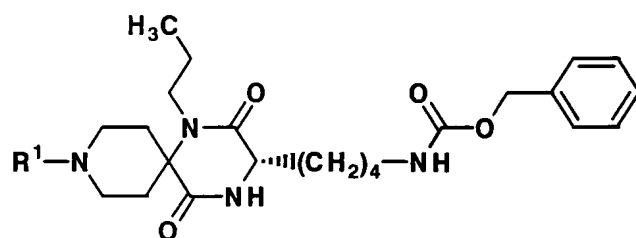
実施例番号	R ¹
21 (H17-60)	
21 (H17-61)	
21 (H17-62)	
21 (H17-63)	
21 (H17-64)	
21 (H17-65)	
21 (H17-66)	

表 17B-11



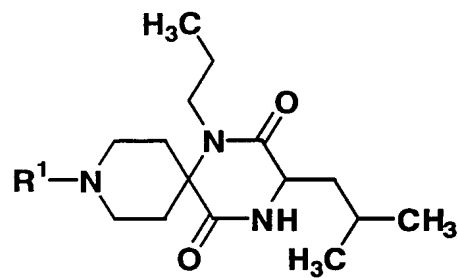
実施例番号	R^1
21 (H17-67)	
21 (H17-68)	
21 (H17-69)	
21 (H17-70)	
21 (H17-71)	
21 (H17-72)	

表 17B-12



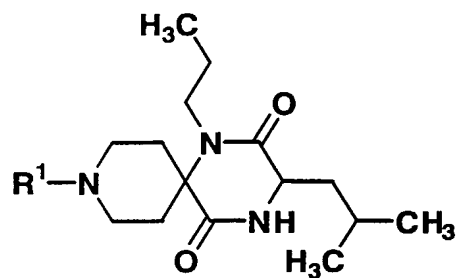
実施例番号	R ¹
21 (H17-73)	
21 (H17-74)	
21 (H17-75)	
21 (H17-76)	
21 (H17-77)	
21 (H17-78)	

表 18B-1



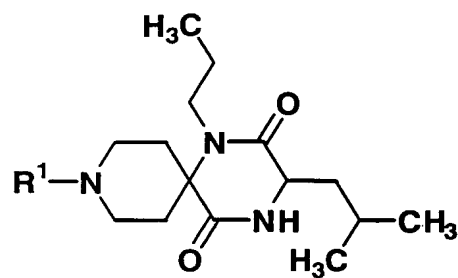
実施例番号	R ¹
21 (H18-1)	
21 (H18-2)	
21 (H18-3)	
21 (H18-4)	
21 (H18-5)	

表 18B-2



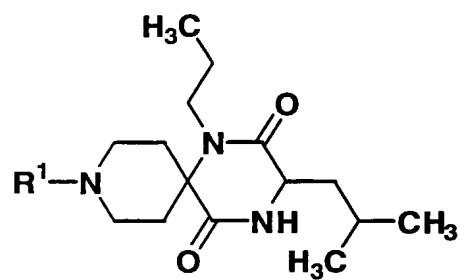
実施例番号	R ¹
21 (H18-6)	
21 (H18-7)	
21 (H18-8)	
21 (H18-9)	
21 (H18-10)	
21 (H18-11)	
21 (H18-12)	

表 18B-3



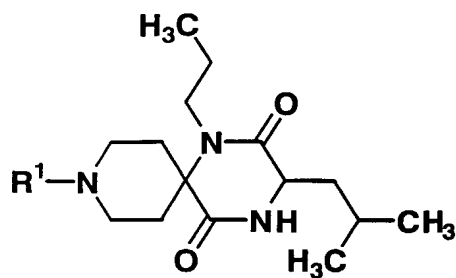
実施例番号	R ¹
21 (H18-13)	
21 (H18-14)	
21 (H18-15)	
21 (H18-16)	
21 (H18-17)	
21 (H18-18)	

表 18B-4



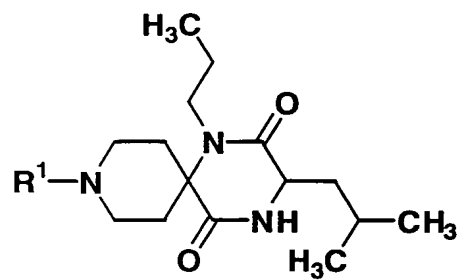
実施例番号	R ¹
21 (H18-19)	
21 (H18-20)	
21 (H18-21)	
21 (H18-22)	
21 (H18-23)	
21 (H18-24)	
21 (H18-25)	

表 18B-5



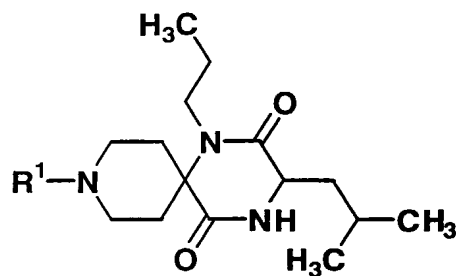
実施例番号	R ¹
21 (H18-26)	
21 (H18-27)	
21 (H18-28)	
21 (H18-29)	
21 (H18-30)	
21 (H18-31)	
21 (H18-32)	

表 18B-6



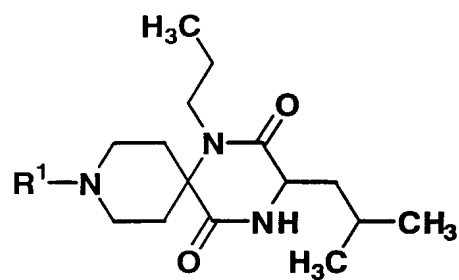
実施例番号	R ¹
21 (H18-33)	
21 (H18-34)	
21 (H18-35)	
21 (H18-36)	
21 (H18-37)	
21 (H18-38)	
21 (H18-39)	

表 18B-7



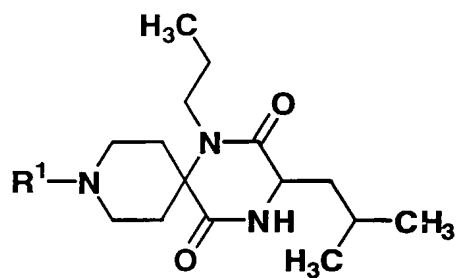
実施例番号	R ¹
21 (H18-40)	
21 (H18-41)	
21 (H18-42)	
21 (H18-43)	
21 (H18-44)	
21 (H18-45)	
21 (H18-46)	
21 (H18-47)	
21 (H18-48)	

表 18B-8



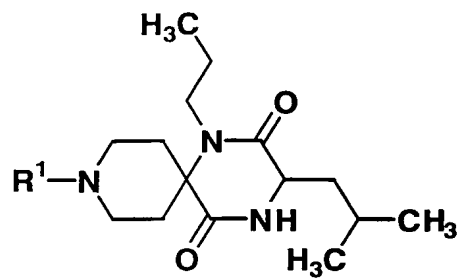
実施例番号	R ¹
21 (H18-49)	
21 (H18-50)	
21 (H18-51)	
21 (H18-52)	
21 (H18-53)	
21 (H18-54)	
21 (H18-55)	

表 18B-9



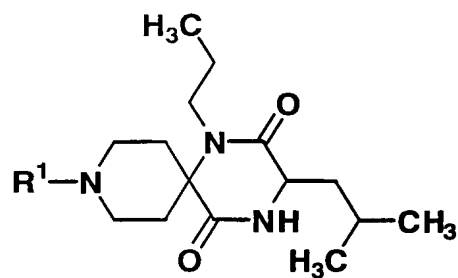
実施例番号	R¹
21 (H18-56)	
21 (H18-57)	
21 (H18-58)	
21 (H18-59)	
21 (H18-60)	
21 (H18-61)	
21 (H18-62)	

表 18B-10



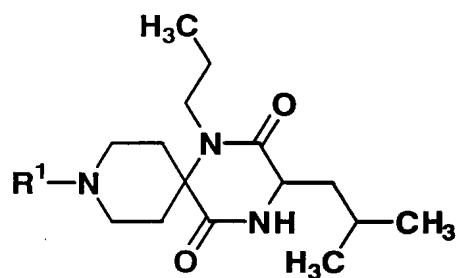
実施例番号	R¹
21 (H18-63)	
21 (H18-64)	
21 (H18-65)	
21 (H18-66)	
21 (H18-67)	
21 (H18-68)	
21 (H18-69)	

表 18B-11



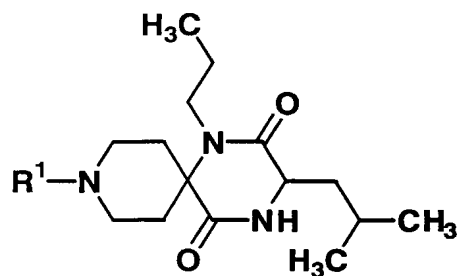
実施例番号	R ¹
21 (H18-70)	<chem>Fc1ccc(S(=O)(=O)N)cc1F</chem>
21 (H18-71)	<chem>COc1cc(S(=O)(=O)N)cc(OC)c1</chem>
21 (H18-72)	<chem>c1ccc2cc(S(=O)(=O)N)ccc2c1</chem>
21 (H18-73)	<chem>N(S(=O)(=O)C=CC1=CC=CC=C1)</chem>
21 (H18-74)	<chem>N(S(=O)(=O)c1ccoc1)</chem>
21 (H18-75)	<chem>N(S(=O)(=O)c1ccsc1)</chem>

表 19B-1



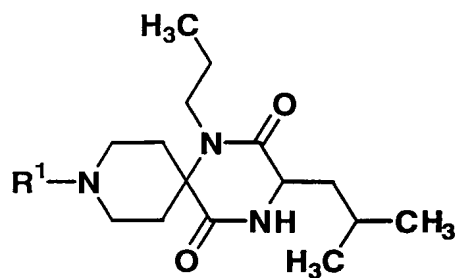
実施例番号	R ¹
21 (H19-1)	
21 (H19-2)	
21 (H19-3)	
21 (H19-4)	
21 (H19-5)	
21 (H19-6)	
21 (H19-7)	
21 (H19-8)	

表 19B-2



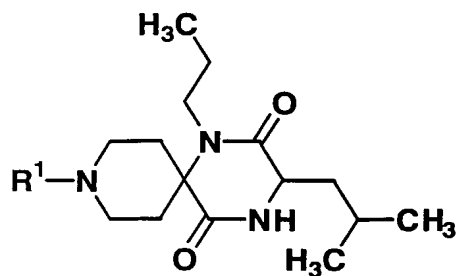
実施例番号	R ¹
21 (H19-9)	
21 (H19-10)	
21 (H19-11)	
21 (H19-12)	
21 (H19-13)	
21 (H19-14)	
21 (H19-15)	

表 19B-3



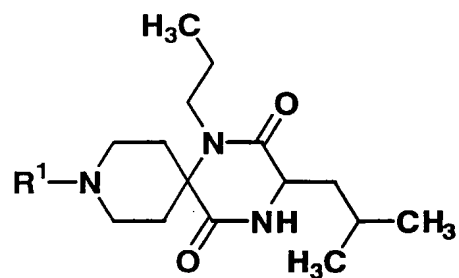
実施例番号	R ¹
21 (H19-16)	
21 (H19-17)	
21 (H19-18)	
21 (H19-19)	
21 (H19-20)	
21 (H19-21)	
21 (H19-22)	

表 19B-4



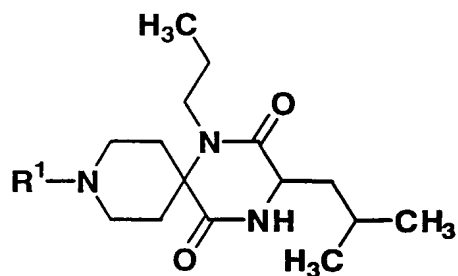
実施例番号	R¹
21 (H19-23)	
21 (H19-24)	
21 (H19-25)	
21 (H19-26)	
21 (H19-27)	
21 (H19-28)	

表 19B-5



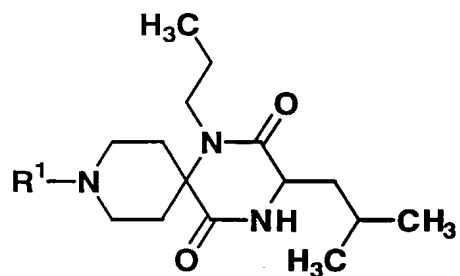
実施例番号	R ¹
21 (H19-29)	
21 (H19-30)	
21 (H19-31)	
21 (H19-32)	
21 (H19-33)	

表 19B-6



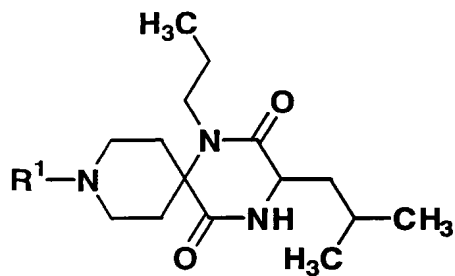
実施例番号	R ¹
21 (H19-34)	
21 (H19-35)	
21 (H19-36)	
21 (H19-37)	
21 (H19-38)	
21 (H19-39)	

表 19B-7



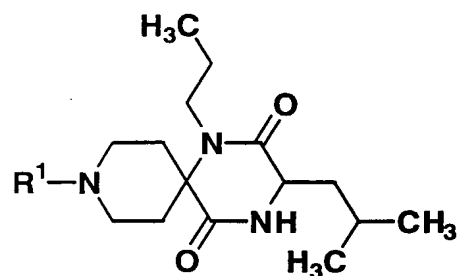
実施例番号	R ¹
21 (H19-40)	
21 (H19-41)	
21 (H19-42)	
21 (H19-43)	
21 (H19-44)	
21 (H19-45)	

表 19B-8



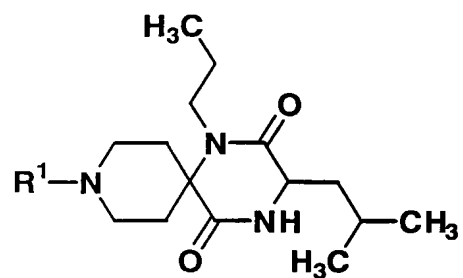
実施例番号	R ¹
21 (H19-46)	
21 (H19-47)	
21 (H19-48)	
21 (H19-49)	
21 (H19-50)	
21 (H19-51)	
21 (H19-52)	
21 (H19-53)	

表 19B-9



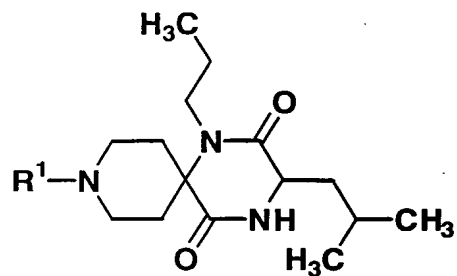
実施例番号	R ¹
21 (H19-54)	
21 (H19-55)	
21 (H19-56)	
21 (H19-57)	
21 (H19-58)	
21 (H19-59)	
21 (H19-60)	

表 19B-10



実施例番号	R ¹
21 (H19-61)	
21 (H19-62)	
21 (H19-63)	
21 (H19-64)	
21 (H19-65)	
21 (H19-66)	

表 19B-11



実施例番号	R ¹
21 (H19-67)	
21 (H19-68)	
21 (H19-69)	
21 (H19-70)	
21 (H19-71)	

表 16C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H16-1)	F	3.84	611 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-2)	F	3.28	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-3)	F	3.70	651 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-4)	F	3.59	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-5)	F	3.59	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-6)	F	3.57	553 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-7)	F	3.60	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-8)	F	3.63	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-9)	F	3.56	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-10)	F	3.59	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-11)	F	3.16	536 (M + H) ⁺ , 431.	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-12)	F	3.15	536 (M + H) ⁺ , 431.	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-13)	F	3.32	536 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-14)	F	3.60	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-15)	F	3.62	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-16)	F	3.29	599 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-17)	F	3.63	644 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-18)	F	3.59	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-19)	F	3.53	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-20)	F	3.56	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-21)	F	3.68	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-22)	F	3.64	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-23)	F	3.47	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-24)	F	3.81	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-25)	F	3.67	561 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-26)	F	3.59	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 16C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H16-27)	F	3.64	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-28)	F	3.68	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-29)	F	3.53	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-30)	F	3.54	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-31)	F	3.84	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-32)	F	3.52	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-33)	F	3.67	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-34)	F	3.84	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-35)	F	3.59	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-36)	F	3.55	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-37)	F	3.45	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-38)	F	3.63	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-39)	F	3.52	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-40)	F	3.57	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-41)	F	3.30	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-42)	F	3.65	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-43)	F	3.28	503 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-44)	F	3.49	533 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-45)	F	3.43	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-46)	F	3.70	541 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-47)	F	3.58	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-48)	F	3.55	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-49)	F	3.69	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-50)	F	3.47	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-51)	F	3.53	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-52)	F	3.46	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 16C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H16-53)	F	3.37	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-54)	F	3.42	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-55)	F	3.54	579 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-56)	F	3.71	643 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-57)	F	3.89	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-58)	F	3.60	595 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-59)	F	3.45	509 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-60)	F	3.81	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-61)	F	3.56	537 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-62)	F	3.87	605 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-63)	F	3.86	697 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-64)	F	3.79	616 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-65)	F	3.63	649 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-66)	F	3.93	639 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-67)	F	4.00	647 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-68)	F	3.97	647 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-69)	F	3.71	629 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-70)	F	3.82	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-71)	F	3.76	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-72)	F	3.81	607 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-73)	F	3.71	631 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-74)	F	4.01	673 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-75)	F	3.91	621 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-76)	F	3.82	597 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-77)	F	3.67	561 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H16-78)	F	3.73	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 17C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H17-1)	F	4.08	724 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-2)	F	3.90	717 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-3)	F	3.87	647 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-4)	F	3.59	649 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-5)	F	3.98	691 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-6)	F	4.01	639 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-7)	F	3.76	601 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-8)	F	3.72	585 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-9)	F	3.33	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-10)	F	3.42	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-11)	F	3.43	516 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-12)	F	3.40	560 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-13)	F	3.54	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-14)	F	3.72	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-15)	F	3.59	550 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-16)	F	3.66	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-17)	F	3.73	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-18)	F	3.60	568 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-19)	F	3.57	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-20)	F	3.62	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-21)	F	3.66	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-22)	F	3.96	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-23)	F	3.76	628 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-24)	F	3.59	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-25)	F	3.85	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-26)	F	3.75	584 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 17C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H17-27)	F	3.74	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-28)	F	3.69	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-29)	F	3.85	642 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-30)	F	3.86	622 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-31)	F	3.86	626 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-32)	F	3.78	626 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-33)	F	3.82	618 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-34)	F	3.86	618 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-35)	F	3.90	650 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-36)	F	3.89	634 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-37)	F	3.66	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-38)	F	3.80	620 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-39)	F	3.76	652 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-40)	F	3.72	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-41)	F	3.64	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-42)	F	3.68	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-43)	F	3.97	606 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-44)	F	3.90	652 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-45)	F	3.83	736 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-46)	F	3.65	602 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-47)	F	3.48	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-48)	F	3.80	785 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-49)	F	3.64	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-50)	F	3.68	666 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-51)	F	3.51	676 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-52)	F	3.61	578 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 17C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H17-53)	F	3.79	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-54)	F	4.24	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-55)	F	3.57	503 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-56)	F	3.62	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-57)	F	3.67	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-58)	F	3.79	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-59)	F	4.03	559 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-60)	F	3.89	605 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-61)	F	4.06	653 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-62)	F	4.35	613 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-63)	F	3.44	533 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-64)	F	3.90	545 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-65)	F	3.67	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-66)	F	3.72	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-67)	F	4.35	613 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-68)	F	3.78	543 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-69)	F	3.79	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-70)	F	3.81	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-71)	F	3.86	626 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-72)	F	3.65	564 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-73)	F	3.39	502 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-74)	F	3.58	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-75)	F	3.79	558 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-76)	F	3.34	544 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-77)	F	4.03	624 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H17-78)	F	3.49	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 18C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H18-1)	F	3.82	923 (2M + H) ⁺ , 462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-2)	F	3.81	462 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-3)	F	3.12	857 (2M + H) ⁺ , 429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-4)	F	3.62	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-5)	F	3.49	807 (2M + H) ⁺ , 404 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-6)	F	3.51	807 (2M + H) ⁺ , 404 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-7)	F	3.49	807 (2M + H) ⁺ , 404 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-8)	F	3.51	755 (2M + H) ⁺ , 378 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-9)	F	3.56	799 (2M + H) ⁺ , 400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-10)	F	3.49	831 (2M + H) ⁺ , 416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-11)	F	3.49	753 (2M + H) ⁺ , 366 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-12)	F	3.00	773 (2M + H) ⁺ , 387 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-13)	F	3.16	387 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-14)	F	3.50	799 (2M + H) ⁺ , 400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-15)	F	3.53	831 (2M + H) ⁺ , 416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-16)	F	3.13	450 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-17)	F	3.57	989 (2M + H) ⁺ , 495 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-18)	F	3.53	957 (2M + H) ⁺ , 479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-19)	F	3.44	831 (2M + H) ⁺ , 416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-20)	F	3.45	811 (2M + H) ⁺ , 406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-21)	F	3.61	759 (2M + H) ⁺ , 380 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-22)	F	3.56	799 (2M + H) ⁺ , 400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-23)	F	3.32	703 (2M + H) ⁺ , 352 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-24)	F	3.75	811 (2M + H) ⁺ , 406 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-25)	F	3.60	823 (2M + H) ⁺ , 412 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-26)	F	3.51	799 (2M + H) ⁺ , 400 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 18C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H18-27)	F	3.55	759 (2M + H) ⁺ , 380 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-28)	F	3.58	783 (2M + H) ⁺ , 392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-29)	F	3.45	771 (2M + H) ⁺ , 386 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-30)	F	3.44	783 (2M + H) ⁺ , 392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-31)	F	3.79	432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-32)	F	3.41	382 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-33)	F	3.61	933 (2M + H) ⁺ , 467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-34)	F	3.80	933 (2M + H) ⁺ , 467 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-35)	F	3.48	859 (2M + H) ⁺ , 430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-36)	F	3.46	831 (2M + H) ⁺ , 416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-37)	F	3.35	751 (2M + H) ⁺ , 376 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-38)	F	3.53	430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-39)	F	3.40	727 (2M + H) ⁺ , 364 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-40)	F	3.48	859 (2M + H) ⁺ , 430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-41)	F	3.11	647 (2M + H) ⁺ , 324 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-42)	F	3.60	759 (2M + H) ⁺ , 380 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-43)	F	3.13	354 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-44)	F	3.35	767 (2M + H) ⁺ , 384 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-45)	F	3.28	753 (2M + H) ⁺ , 377 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-46)	F	3.60	783 (2M + H) ⁺ , 392 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-47)	F	3.47	731 (2M + H) ⁺ , 366 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-48)	F	3.44	731 (2M + H) ⁺ , 366 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-49)	F	3.62	863 (2M + H) ⁺ , 432 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-50)	F	3.34	815 (2M + H) ⁺ , 408 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-51)	F	3.42	821 (2M + H) ⁺ , 411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-52)	F	3.33	703 (2M + H) ⁺ , 352 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 18C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H18-53)	F	3.22	675 (2M + H) ⁺ , 338 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-54)	F	3.27	699 (2M + H) ⁺ , 350 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-55)	F	3.45	859 (2M + H) ⁺ , 430 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-56)	F	3.64	987 (2M + H) ⁺ , 494 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-57)	F	3.86	891 (2M + H) ⁺ , 446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-58)	F	3.51	446 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-59)	F	3.29	360 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-60)	F	3.76	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-61)	F	3.45	797 (2M + Na) ⁺ , 388 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-62)	F	3.82	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-63)	F	3.55	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-64)	F	3.90	490 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-65)	F	3.99	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-66)	F	3.97	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-67)	F	3.62	480 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-68)	F	3.77	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-69)	F	3.70	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-70)	F	3.76	458 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-71)	F	3.62	985 (2M + Na) ⁺ , 482 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-72)	F	3.89	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-73)	F	3.79	448 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-74)	F	3.58	412 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H18-75)	F	3.65	428 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 19C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H19-1)	F	3.48	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-2)	F	3.96	542 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-3)	F	3.68	452 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-4)	F	3.64	436 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-5)	F	3.13	353 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-6)	F	3.25	367 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-7)	F	3.26	367 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-8)	F	3.21	411 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-9)	F	3.37	381 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-10)	F	3.63	435 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-11)	F	3.45	401 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-12)	F	3.55	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-13)	F	3.65	409 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-14)	F	3.49	419 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-15)	F	3.43	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-16)	F	3.50	407 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-17)	F	3.54	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-18)	F	3.90	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-19)	F	3.67	481 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-20)	F	3.46	435 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-21)	F	3.77	443 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-22)	F	3.64	435 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-23)	F	3.64	443 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-24)	F	3.58	443 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-25)	F	3.79	493 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-26)	F	3.78	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 19C-2

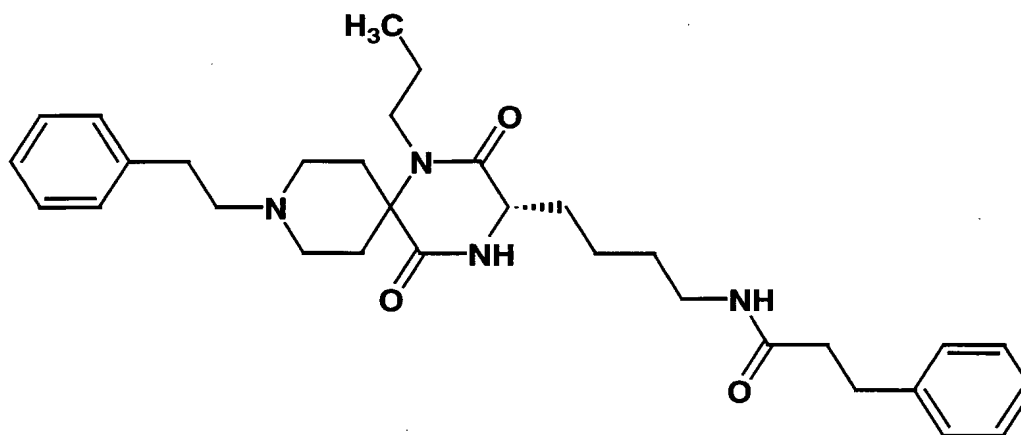
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H19-27)	F	3.80	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-28)	F	3.70	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-29)	F	3.74	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-30)	F	3.79	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-31)	F	3.85	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-32)	F	3.81	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-33)	F	3.56	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-34)	F	3.72	471 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-35)	F	3.67	505 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-36)	F	3.63	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-37)	F	3.57	447 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-38)	F	3.59	447 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-39)	F	3.91	457 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-40)	F	3.77	587 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-41)	F	3.50	453 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-42)	F	3.34	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-43)	F	3.75	638 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-44)	F	3.54	437 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-45)	F	3.58	517 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-46)	F	3.35	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-47)	F	3.47	429 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-48)	F	3.70	382 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-49)	F	4.22	438 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-50)	F	3.43	354 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-51)	F	3.50	366 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-52)	F	3.57	368 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 19C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
21 (H19-53)	F	3.72	382 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-54)	F	3.99	410 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-55)	F	4.03	504 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-56)	F	4.37	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-57)	F	3.28	384 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-58)	F	3.86	396 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-59)	F	3.56	368 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-60)	F	3.60	380 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-61)	F	4.39	464 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-62)	F	3.71	394 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-63)	F	3.74	416 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-64)	F	3.81	477 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-65)	F	3.55	415 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-66)	F	3.22	353 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-67)	F	3.46	381 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-68)	F	3.71	409 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-69)	F	3.17	395 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-70)	F	3.97	475 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
21 (H19-71)	F	3.34	379 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

実施例 2 2

(3S) - 1 - プロピル - 2, 5 - ジオキソ - 3 - (4 - (3 - フェニルプロパノイル) アミノブチル) - 9 - (2 - フェニルエチル) - 1, 4, 9 - トリアザスピロ [5. 5] ウンデカン



5

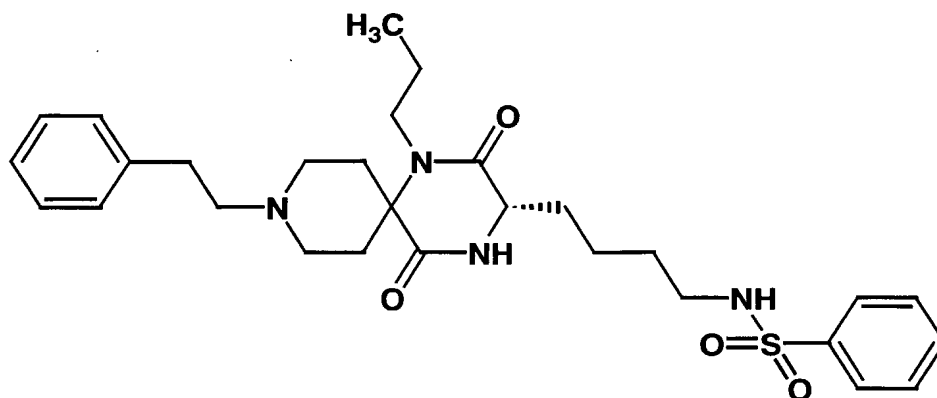
実施例 1 4 で製造した化合物 (5 mg) のジクロロエタン (0.5 ml) 溶液に、ピリジン (2 μ l)、3 - フェニルプロパノイルクロライド (4 μ l) を加えた。反応混合物を室温で 3 時間攪拌した。反応混合物にメタノールを加え、予めメタノール (3 ml) で洗浄したイオン交換樹脂 (OASIS M
10 CX、Waters、60 mg) に吸着させた。メタノール (2 ml) で洗浄し、10% トリエチルアミン - メタノール溶液 (2 ml) で溶出した。溶出液を濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物 (1.6 mg) を得た。

TLC : Rf 0.49 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;

NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.10 (m, 10H), 4.03 (m, 1H), 3.60-3.30 (m, 2H), 3.14
15 (m, 2H), 3.06-2.90 (m, 3H), 2.90-2.75 (m, 4H), 2.75-2.60 (m, 3H), 2.45 (t, J = 7.4 Hz, 2H), 2.30-2.00 (m, 2H), 2.00-1.70 (m, 4H), 1.70-1.20 (m, 6H), 0.93 (t, J = 7.2 Hz, 3H)。

実施例 2 2 (1)

(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-ベンゼンスルホニルアミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



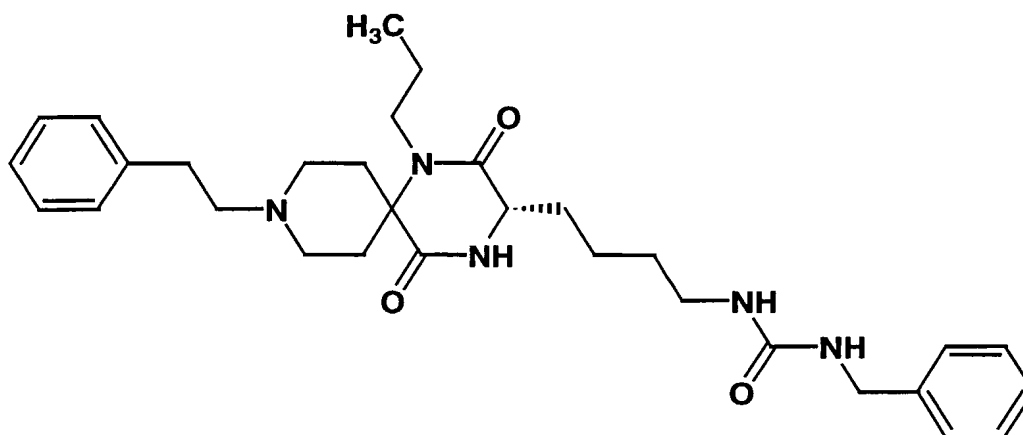
- 5 実施例14で製造した化合物(5mg)、ピリジン(2 μ l)、ベンゼンスルホニルクロライド(3 μ l)を用いて、実施例22と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物(4.4mg)を得た。

TLC: Rf 0.49 (クロロホルム:メタノール=10:1) ;

- 10 NMR (CD₃OD) : δ 7.84 (m, 2H), 7.59 (m, 3H), 7.34-7.10 (m, 5H), 4.01 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.55-3.30 (m, 2H), 3.05-2.90 (m, 3H), 2.90-2.75 (m, 4H), 2.75-2.60 (m, 3H), 2.30-2.00 (m, 2H), 1.96 (m, 2H), 1.88-1.70 (m, 2H), 1.70-1.20 (m, 6H), 0.94 (t, J = 7.4 Hz, 3H)。

実施例22(2)

- 15 (3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(N-ベンジルカルバモイル)アミノブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン



実施例 1 4 で製造した化合物 (5 mg)、ベンジルイソシアネート (3 μ l) を用いて、実施例 2 2 と同様の操作をし、以下の物性値を有する本発明化合物 (7 mg) を得た。

- 5 TLC : R f 0.46 (クロロホルム : メタノール = 10 : 1) ;
 NMR (CD₃OD) : δ 7.40-7.10 (m, 10H), 4.30 (s, 2H), 4.04 (t, J = 5.0 Hz, 1H), 3.55-3.30 (m, 2H), 3.15 (t, J = 6.6 Hz, 3H), 3.05-2.90 (m, 3H), 2.90-2.75 (m, 3H), 2.75-2.60 (m, 2H), 2.35-2.05 (m, 2H), 2.02-1.70 (m, 4H), 1.70-1.20 (m, 6H), 0.93 (t, J = 7.4 Hz, 3H)。

10

実施例 2 2 (H 2 0 - 1) ~ 2 2 (H 2 1 - 7 7)

- 実施例 1 4 で製造した化合物と相当する酸クロライド誘導体、スルホニルクロライド誘導体またはイソシアネート誘導体を用いて、実施例 2 2、2 2 (1) または 2 2 (2) と同様の操作をし、以下の表 2 0 A - 1 ~ 2 1 A - 1 1 に化合物名を示し、表 2 0 B - 1 ~ 2 1 B - 1 2 に構造式を示した本発明化合物を得た。また、それらの本発明化合物の物性値を、以下の表 2 0 C - 1 ~ 2 1 C - 3 に示した。
- 15

表 20A-1

実施例番号	化合物名
22 (H20-1)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ビフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-2)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4,7,7-トリメチル-2-オキサ-3-オキソビシクロ[2.2.1]ヘプタン-1-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-3)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ジメチルアミノフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-4)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-(2-クロロフェニル)-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-5)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-フルオロフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-6)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-フルオロフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-7)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-フルオロフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-2

実施例番号	化合物名
22 (H20-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(シクロペンチルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-メチルフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-メトキシフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2,2-ジメチルプロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ピリジン-3-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ピリジン-2-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-3

実施例番号	化合物名
22 (H20-15)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルオキシアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-16)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-エチル-2,3-ジオキソピペラジニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-17)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-フェニルチオピリジン-3-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-18)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-フェニルオキシピリジン-3-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-19)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-メトキシフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-20)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-(チオフェン-2-イル)アセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-21)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ヘキサノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-4

実施例番号	化合物名
22 (H20-22)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-メチルフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-23)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-メチルプロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-24)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3-シクロペンチルプロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-25)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2E)-3-フェニル-2-プロペノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-26)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-メチルフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-27)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3,3-ジメチルブタノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-28)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(シクロヘキシルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-5

実施例番号	化合物名
22 (H20-29)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(フェニルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-30)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(チオフェン-2-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-31)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,6,6-トリメチル-1-シクロヘキセニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-32)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-フェニル-5-メチルイソオキサゾール-4-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-33)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((5-メチル-2-フェニル-1,2,3-トリアゾール-4-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-34)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-(3-メトキシフェニル)アセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-35)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-メトキシフェニルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-6

実施例番号	化合物名
22 (H20-36)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((フラン-2-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-37)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-ベンジルオキシアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-38)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(シクロブチルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-39)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-(4-メトキシフェニル)アセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-40)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(アセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-41)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-メチルペンタノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-42)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-メトキシアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-7

実施例番号	化合物名
22 (H20-43)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3-メチルチオプロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-44)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-シクロペンチルアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-45)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ペンタノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-46)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3-メチルプロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-47)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルチオアセチルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-48)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-メチル-1,2,3-チアジアゾール-5-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-49)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-シアノフェニル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-8

実施例番号	化合物名
22 (H20-50)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ブタノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-51)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(プロパノイルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-52)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(シクロプロピルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-53)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2H-ベンゾ[3,4-d]1,3-ジオキソラン-5-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-54)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1-フェニル-5-プロピルピラゾール-4-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-55)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((5-(1,1-ジメチルエチル)-2-メチルフラン-3-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-56)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1-(1,1-ジメチルエチル)-3-メチルピラゾール-5-イル)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-9

実施例番号	化合物名
22 (H20-57)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(メチルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-58)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ペンチルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-59)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(1-メチルエチルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-60)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-クロロフェニルスルホニル)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-61)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-ヨードフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-62)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-ニトロフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-63)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-(メチルスルホニル)フェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-10

実施例番号	化合物名
22 (H20-64)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-トリフルオロメチルフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-65)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-フェニルフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-66)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-フェニルフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-67)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3,4-ジフルオロフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-68)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2,6-ジフルオロフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-69)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2,5-ジフルオロフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-70)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2,5-ジメトキシフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20A-11

実施例番号	化合物名
22 (H20-71)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-クロロ-4-トリフルオロメチルフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-72)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-ナフチルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-73)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1E)-2-フェニルビニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-74)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(フラン-2-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H20-75)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(チオフェン-2-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-1

実施例番号	化合物名
22 (H21-1)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-ブロモ-2,5-ジクロロチオフェン-3-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-2)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(5-フェニルスルホニルチオフェン-2-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-3)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(7-クロロベンゾフラザン-4-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-4)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-メチル-2-アセチルアミノチアゾール-5-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-5)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(2-メトキシ-ジベンゾフラン-3-イルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-6)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(3,4-ジクロロフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-7)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-メトキシフェニルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-2

実施例番号	化合物名
22 (H21-8)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルスルホニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-9)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((エチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-10)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((プロピルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-11)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1-メチルエチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-12)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((ブチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-13)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-クロロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-14)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((フェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-3

実施例番号	化合物名
22 (H21-15)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-メチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-16)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((ヘキシルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-17)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-フルオロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-18)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((ベンジルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-19)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((シクロヘキシルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-20)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-メチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-21)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((オクチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-4

実施例番号	化合物名
22 (H21-22)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ブromoフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-23)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-(チオフェン-2-イル)エチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-24)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-25)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-クロロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-26)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,4,5-トリメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-27)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,4,6-トリメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-28)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-フェニルオキシフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-5

実施例番号	化合物名
22 (H21-29)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ブチルオキシフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-30)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-フェニルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-31)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-フェニルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-32)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-トリフルオロメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-33)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3,4-ジクロロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-34)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ブチルオキシカルボニルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-35)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,6-ビス(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-6

実施例番号	化合物名
22 (H21-36)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,5-ジメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-37)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-エチル-6-(1-メチルエチル)フェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-38)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,4,6-トリクロロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-39)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3,4-ジメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-40)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-メチルチオフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-41)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-メチルチオフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-42)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((4-ブチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-7

実施例番号	化合物名
22 (H21-43)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-クロロ-5-トリフルオロメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-44)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,6-ジブromo-4-エチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-45)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1-エトキシカルボニル-2-メチルプロピルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-46)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((フェニルカルボニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-47)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,4,6-トリブromoフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-48)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,5-ジフルオロフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-49)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3,5-ビス(メトキシカルボニル)フェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-8

実施例番号	化合物名
22 (H21-50)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((6,7-メチレンジオキシクマリン-4-イルメチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-51)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,6-ジメチルフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-52)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-メチルプロピルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-53)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-エチルヘキシルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-54)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(エトキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-55)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(アリルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-56)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(プロピルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-9

実施例番号	化合物名
22 (H21-57)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ブチルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-58)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ヘキシルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-59)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2,2,2-トリクロロエチルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-60)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((フルオレン-9-イルメチルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-61)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1S,5S,2R)-5-メチル-2-(1-メチルエチル)シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-62)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2-メトキシエトキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-63)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ペンチルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

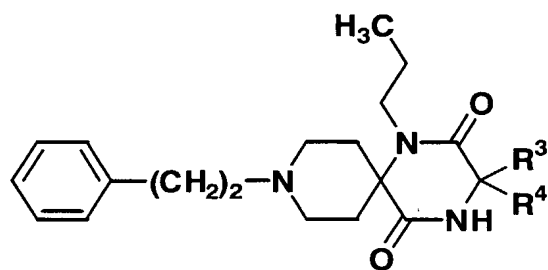
表 21A-10

実施例番号	化合物名
22 (H21-64)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1-メチルエチルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-65)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((3-ブテニルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-66)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((2S,1R,5R)-メチル-2-(1-メチルエチル)シクロヘキシルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-67)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(シクロペンチルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-68)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((1,1-ジメチルエチルオキシ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-69)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ベンジルオキシカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-70)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((N,N-ジフェニルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 21A-11

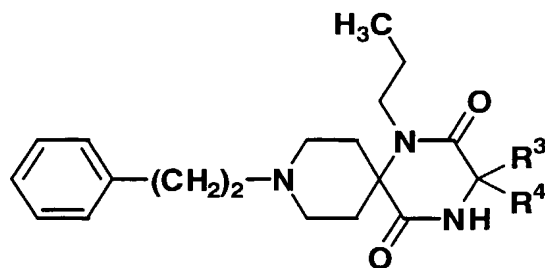
実施例番号	化合物名
22 (H21-71)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((N-フェニル-N-メチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-72)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((N,N-ジメチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-73)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((N,N-ジエチルアミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-74)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-((N,N-ビス(1-メチルエチル)アミノ)カルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-75)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(モルホリン-4-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-76)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(カルバゾール-9-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン
22 (H21-77)	(3S)-1-プロピル-2,5-ジオキソ-3-(4-(ピロリジン-1-イルカルボニルアミノ)ブチル)-9-(2-フェニルエチル)-1,4,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン

表 20B-1



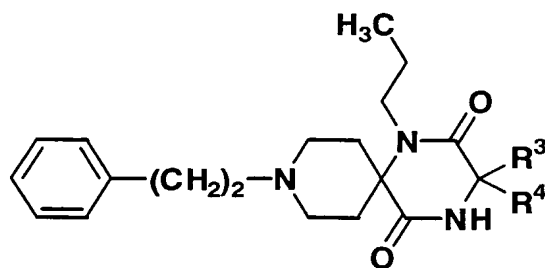
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-1)	H	
22 (H20-2)	H	
22 (H20-3)	H	
22 (H20-4)	H	
22 (H20-5)	H	

表 20B-2



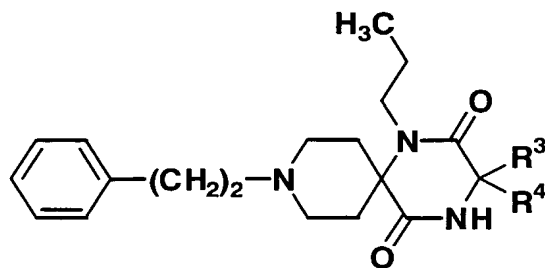
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-6)	H	
22 (H20-7)	H	
22 (H20-8)	H	
22 (H20-9)	H	
22 (H20-10)	H	
22 (H20-11)	H	

表 20B-3



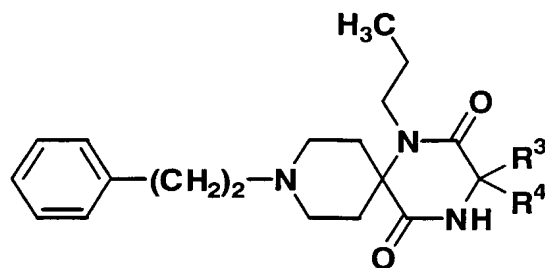
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-12)	H	
22 (H20-13)	H	
22 (H20-14)	H	
22 (H20-15)	H	
22 (H20-16)	H	
22 (H20-17)	H	

表 20B-4



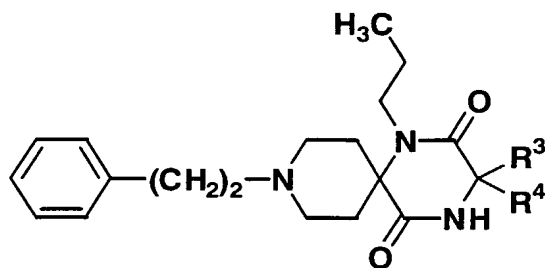
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-18)	H	
22 (H20-19)	H	
22 (H20-20)	H	
22 (H20-21)	H	
22 (H20-22)	H	
22 (H20-23)	H	

表 20B-5



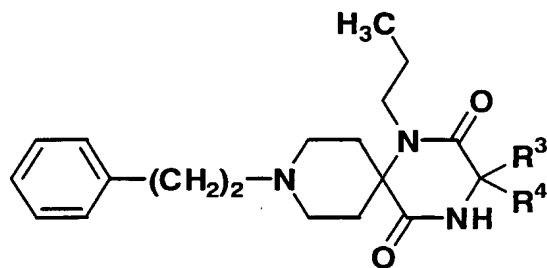
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-24)	H	
22 (H20-25)	H	
22 (H20-26)	H	
22 (H20-27)	H	
22 (H20-28)	H	
22 (H20-29)	H	
22 (H20-30)	H	

表 20B-6



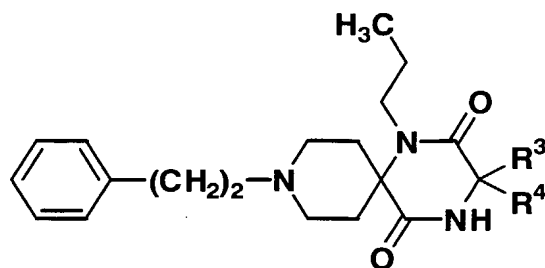
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-31)	H	
22 (H20-32)	H	
22 (H20-33)	H	
22 (H20-34)	H	
22 (H20-35)	H	
22 (H20-36)	H	

表 20B-7



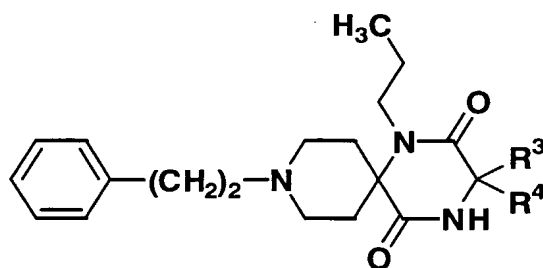
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-37)	H	
22 (H20-38)	H	
22 (H20-39)	H	
22 (H20-40)	H	
22 (H20-41)	H	
22 (H20-42)	H	
22 (H20-43)	H	
22 (H20-44)	H	

表 20B-8



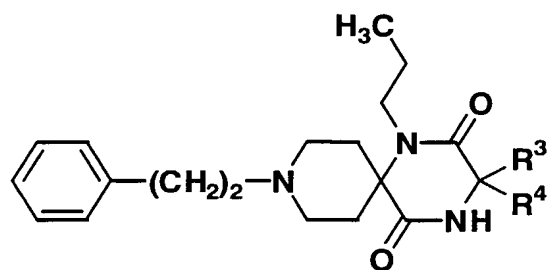
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-45)	H	
22 (H20-46)	H	
22 (H20-47)	H	
22 (H20-48)	H	
22 (H20-49)	H	
22 (H20-50)	H	
22 (H20-51)	H	
22 (H20-52)	H	

表 20B-9



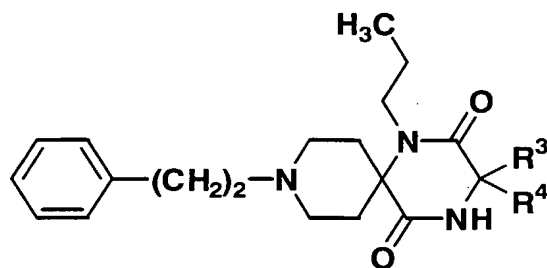
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-53)	H	
22 (H20-54)	H	
22 (H20-55)	H	
22 (H20-56)	H	
22 (H20-57)	H	
22 (H20-58)	H	
22 (H20-59)	H	

表 20B-10



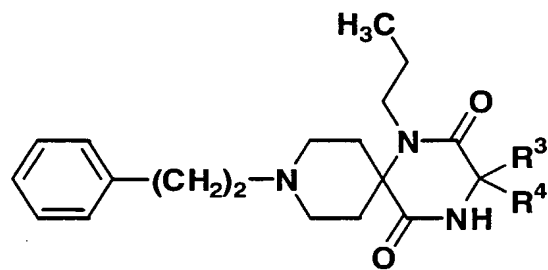
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-60)	H	
22 (H20-61)	H	
22 (H20-62)	H	
22 (H20-63)	H	
22 (H20-64)	H	
22 (H20-65)	H	

表 20B-11



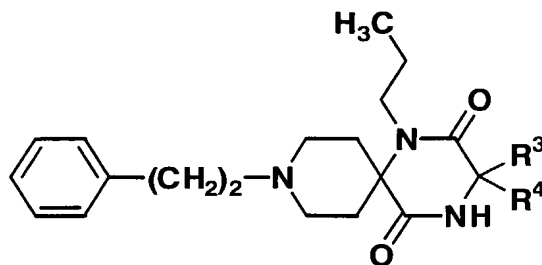
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-66)	H	
22 (H20-67)	H	
22 (H20-68)	H	
22 (H20-69)	H	
22 (H20-70)	H	
22 (H20-71)	H	

表 20B-12



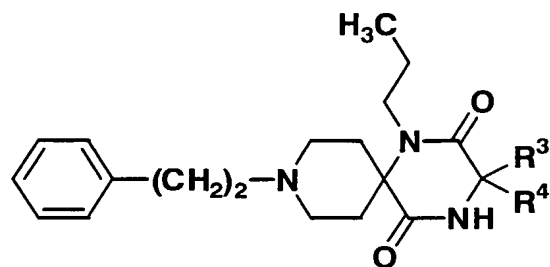
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H20-72)	H	
22 (H20-73)	H	
22 (H20-74)	H	
22 (H20-75)	H	

表 21B-1



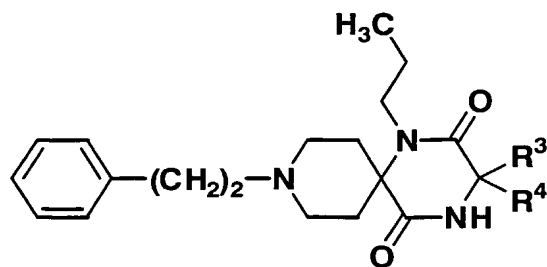
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-1)	H	
22 (H21-2)	H	
22 (H21-3)	H	
22 (H21-4)	H	
22 (H21-5)	H	
22 (H21-6)	H	
22 (H21-7)	H	

表 21B-2



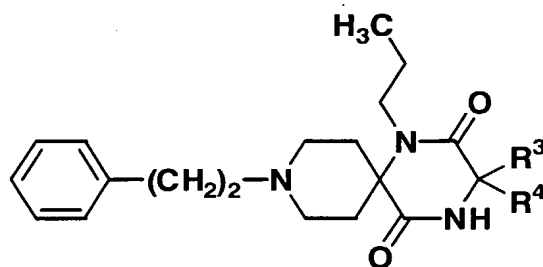
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-8)	H	
22 (H21-9)	H	
22 (H21-10)	H	
22 (H21-11)	H	
22 (H21-12)	H	
22 (H21-13)	H	
22 (H21-14)	H	
22 (H21-15)	H	

表 21B-3



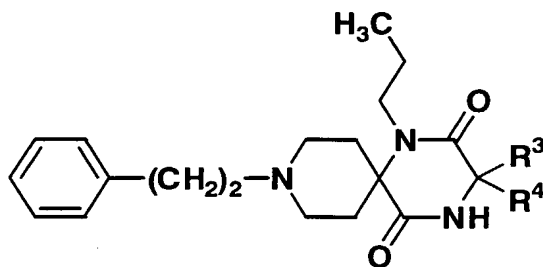
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-16)	H	
22 (H21-17)	H	
22 (H21-18)	H	
22 (H21-19)	H	
22 (H21-20)	H	
22 (H21-21)	H	
22 (H21-22)	H	
22 (H21-23)	H	

表 21B-4



実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-24)	H	
22 (H21-25)	H	
22 (H21-26)	H	
22 (H21-27)	H	
22 (H21-28)	H	
22 (H21-29)	H	
22 (H21-30)	H	

表 21B-5



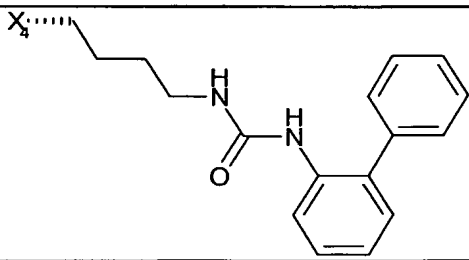
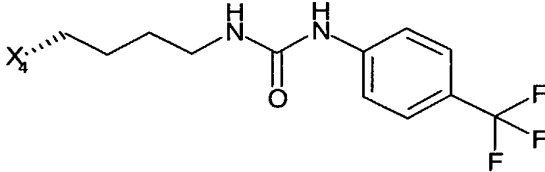
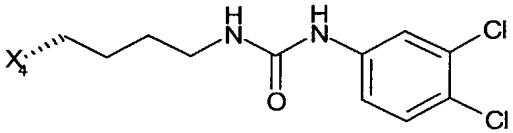
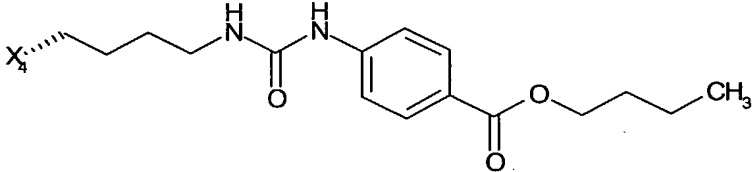
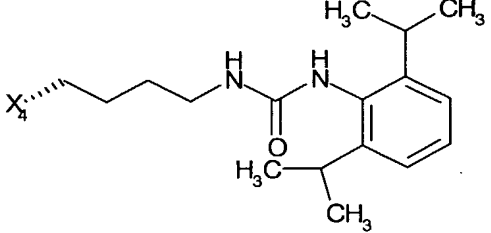
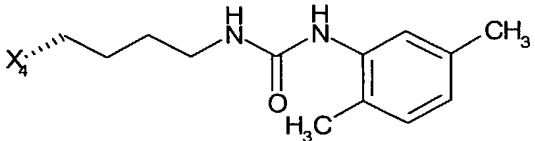
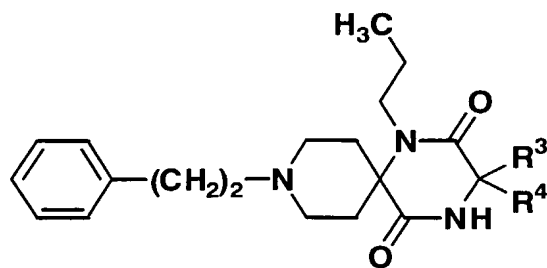
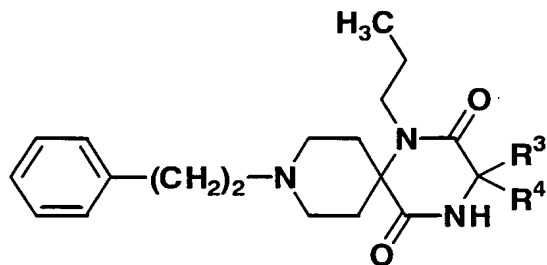
实施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-31)	H	
22 (H21-32)	H	
22 (H21-33)	H	
22 (H21-34)	H	
22 (H21-35)	H	
22 (H21-36)	H	

表 21B-6



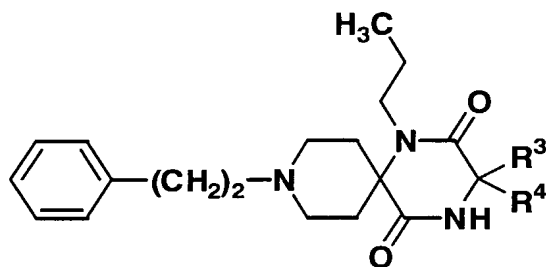
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-37)	H	
22 (H21-38)	H	
22 (H21-39)	H	
22 (H21-40)	H	
22 (H21-41)	H	
22 (H21-42)	H	

表 21B-7



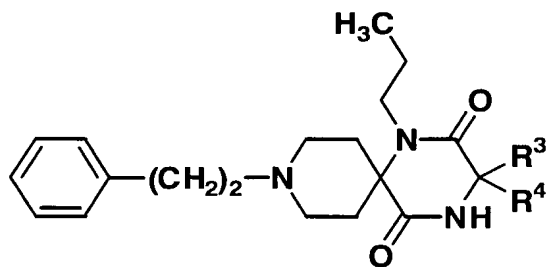
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-43)	H	
22 (H21-44)	H	
22 (H21-45)	H	
22 (H21-46)	H	
22 (H21-47)	H	
22 (H21-48)	H	

表 21B-8



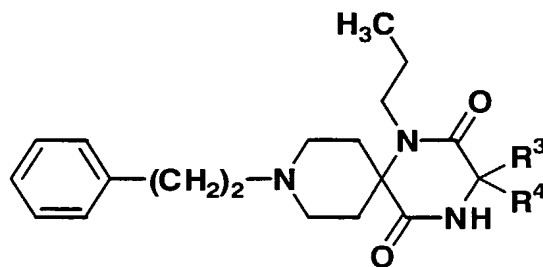
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-49)	H	
22 (H21-50)	H	
22 (H21-51)	H	
22 (H21-52)	H	
22 (H21-53)	H	
22 (H21-54)	H	

表 21B-9



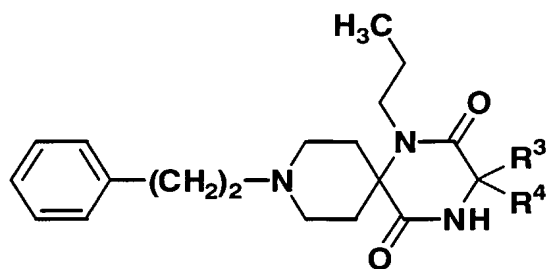
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-55)	H	
22 (H21-56)	H	
22 (H21-57)	H	
22 (H21-58)	H	
22 (H21-59)	H	
22 (H21-60)	H	
22 (H21-61)	H	

表 21B-10



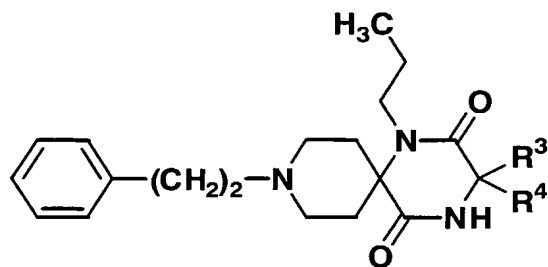
実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-62)	H	
22 (H21-63)	H	
22 (H21-64)	H	
22 (H21-65)	H	
22 (H21-66)	H	
22 (H21-67)	H	
22 (H21-68)	H	

表 21B-11



実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-69)	H	
22 (H21-70)	H	
22 (H21-71)	H	
22 (H21-72)	H	
22 (H21-73)	H	
22 (H21-74)	H	

表 21B-12



実施例番号	R ³	R ⁴
22 (H21-75)	H	
22 (H21-76)	H	
22 (H21-77)	H	

表 20C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H20-1)	F	3.43	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-2)	F	3.43	581 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-3)	F	3.09	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-4)	F	3.32	620 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-5)	F	3.24	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-6)	F	3.23	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-7)	F	3.20	523 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-8)	F	3.17	497 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-9)	F	3.26	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-10)	F	3.20	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-11)	F	3.16	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-12)	F	2.95	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-13)	F	3.11	506 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-14)	F	3.20	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-15)	F	3.25	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-16)	F	3.05	569 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-17)	F	3.25	614 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-18)	F	3.31	598 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-19)	F	3.23	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-20)	F	3.17	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-21)	F	3.24	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-22)	F	3.25	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-23)	F	3.06	471 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-24)	F	3.33	525 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-25)	F	3.28	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-26)	F	3.20	519 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 20C-2

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H20-27)	F	3.20	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-28)	F	3.23	511 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-29)	F	3.18	505 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-30)	F	3.16	511 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-31)	F	3.36	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-32)	F	3.27	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-33)	F	3.42	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-34)	F	3.20	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-35)	F	3.20	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-36)	F	3.09	495 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-37)	F	3.27	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-38)	F	3.11	483 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-39)	F	3.20	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-40)	F	2.96	443 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-41)	F	3.22	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-42)	F	3.00	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-43)	F	3.07	503 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-44)	F	3.23	511 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-45)	F	3.16	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-46)	F	3.12	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-47)	F	3.27	551 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-48)	F	3.11	527 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-49)	F	3.20	530 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-50)	F	3.07	471 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-51)	F	3.01	457 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-52)	F	3.07	469 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 20C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H20-53)	F	3.18	549 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-54)	F	3.34	613 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-55)	F	3.49	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-56)	F	3.22	565 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-57)	F	3.03	479 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-58)	F	3.34	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-59)	F	3.14	507 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-60)	F	3.40	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-61)	F	3.38	667 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-62)	F	3.35	586 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-63)	F	3.22	619 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-64)	F	3.45	609 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-65)	F	3.51	617 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-66)	F	3.49	617 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-67)	F	3.38	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-68)	F	3.29	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-69)	F	3.33	577 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-70)	F	3.29	601 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-71)	F	3.51	643 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-72)	F	3.42	591 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-73)	F	3.39	567 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-74)	F	3.22	531 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H20-75)	F	3.23	547 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 21C-1

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H21-1)	F	3.51	694 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-2)	F	3.45	687 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-3)	F	3.40	617 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-4)	F	3.17	619 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-5)	F	3.52	661 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-6)	F	3.47	609 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-7)	F	3.28	571 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-8)	F	3.29	555 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-9)	F	3.03	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-10)	F	3.09	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-11)	F	3.07	486 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-12)	F	3.16	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-13)	F	3.33	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-14)	F	3.22	520 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-15)	F	3.27	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-16)	F	3.34	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-17)	F	3.25	538 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-18)	F	3.22	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-19)	F	3.25	526 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-20)	F	3.29	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-21)	F	3.52	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-22)	F	3.37	600 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-23)	F	3.24	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-24)	F	3.44	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-25)	F	3.34	554 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-26)	F	3.36	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 21C-2

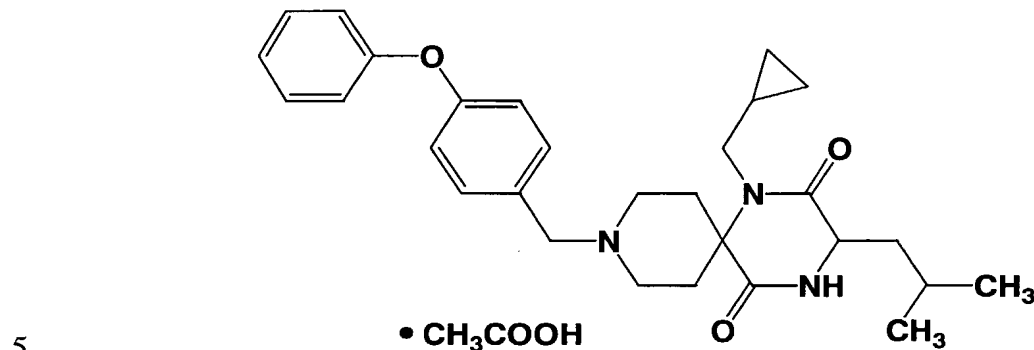
実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H21-27)	F	3.31	562 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-28)	F	3.47	612 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-29)	F	3.47	592 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-30)	F	3.47	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-31)	F	3.40	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-32)	F	3.42	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-33)	F	3.44	588 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-34)	F	3.49	620 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-35)	F	3.47	604 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-36)	F	3.31	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-37)	F	3.42	590 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-38)	F	3.36	623 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-39)	F	3.33	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-40)	F	3.29	566 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-41)	F	3.31	566 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-42)	F	3.53	576 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-43)	F	3.49	622 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-44)	F	3.42	706 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-45)	F	3.25	572 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-46)	F	3.23	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-47)	F	3.40	757 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-48)	F	3.33	556 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-49)	F	3.33	636 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-50)	F	3.18	646 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-51)	F	3.23	548 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-52)	F	3.30	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

表 21C-3

実施例 番号	HPLC 条件	保持時間 (分)	Mass データ	Mass 条件
22 (H21-53)	F	3.64	557 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-54)	F	3.13	473 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-55)	F	3.20	485 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-56)	F	3.21	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-57)	F	3.31	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-58)	F	3.49	529 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-59)	F	3.38	575 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-60)	F	3.57	623 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-61)	F	3.69	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-62)	F	3.09	503 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-63)	F	3.40	515 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-64)	F	3.22	487 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-65)	F	3.25	499 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-66)	F	3.69	583 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-67)	F	3.31	513 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-68)	F	3.28	501 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-69)	F	3.34	535 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-70)	F	3.40	596 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-71)	F	3.23	534 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-72)	F	3.01	472 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-73)	F	3.12	500 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-74)	F	3.27	528 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-75)	F	3.01	514 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-76)	F	3.49	574 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)
22 (H21-77)	F	3.07	498 (M + H) ⁺ .	ESI (Pos., 20 V)

実施例 2 3

1-シクロプロピルメチル-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェノキシフェニル)-1,3,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン・酢酸塩



- 参考例 2 で製造した樹脂 (3) (0.5 g) のテトラヒドロフラン/メタノール (1 : 1 ; 5 ml) の懸濁液に、N-アリルオキシカルボニル-4-ピペリドン (0.396 g)、シクロプロピルメチルアミン (0.189 ml) および N-(t-ブチルオキシカルボニル) ロイシン (0.542 g) を加え、65℃で18時間
- 10 攪拌した。反応溶液を室温で冷却し、樹脂をろ取した。得られた樹脂をジメチルホルムアミド (5 ml × 2 回)、塩化メチレン (5 ml × 2 回)、メタノール (5 ml × 2 回) および塩化メチレン (5 ml × 2 回) で洗浄した。得られた樹脂の塩化メチレン (5 ml) 懸濁液に、酢酸 (0.149 ml)、水素化トリブチルスズ (0.351 ml) およびテトラキストリフェニルホスフィンパラ
- 15 ジウム (0) 錯体 (50 mg) を加え、室温で6時間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、塩化メチレン (5 ml × 4 回) およびジメチルホルムアミド (5 ml × 3 回) で洗浄した。得られた樹脂 1% 酢酸 - ジメチルホルムアミド溶液 (5 ml) に懸濁し、そこに 4-フェニルオキシベンゾアルデヒド (0.252 g)、トリアセトキシ水素化ホウ素ナトリウム (0.277 g) を加え、室
- 20 温で15時間攪拌した。反応溶液から樹脂をろ取し、メタノール (5 ml × 1 回)、ジメチルホルムアミド (5 ml × 3 回)、メタノール (5 ml × 4 回)

および塩化メチレン（5 ml × 4回）で洗浄した。得られた樹脂を、50%トリフルオロ酢酸-塩化メチレン（5 ml）溶液に懸濁し、室温で5分間攪拌した。反応溶液をろ過し、得られた樹脂を再度50%トリフルオロ酢酸-塩化メチレン溶液（5 ml）に懸濁し、室温で30分間攪拌した。反応溶液
 5 からろ取した樹脂を、塩化メチレン（5 ml × 3回）、1.25M酢酸-トルエン溶液（5 ml × 3回）で洗浄した。得られた樹脂を1.25M酢酸-トルエン溶液（5 ml）に懸濁し、90℃で23時間攪拌した。反応溶液をろ過し、得られた樹脂をクロロホルム-メタノール（1:1; 2 ml × 2回）で洗浄した。ろ液と洗浄液を濃縮し、以下の物性値を有する本発明化合物（274 mg）を得た。
 10

TLC: R_f 0.40（クロロホルム:メタノール=20:1）;

NMR (CD₃OD): δ 7.49 (m, 2H), 7.40 (m, 2H), 7.18 (m, 2H), 7.04 (m, 3H), 4.33 (s, 2H), 4.04 (dd, J = 8.1, 4.8 Hz, 1H), 3.78 (m, 2H), 3.52 (m, 2H), 3.35 (m, 2H), 2.45 - 2.10 (m, 4H), 1.98 (s, 3H, CH₃COOH), 1.97 - 1.58 (m, 4H),
 15 0.94 (d, J = 6.0 Hz, 6H), 0.51 (m, 2H), 0.36 (m, 2H)。

実施例23 (1)

1-(チオフェン-2-イルメチル)-2,5-ジオキソ-3-(2-メチルプロピル)-9-(4-フェノキシフェニル)-1,3,9-トリアザスピロ[5.5]ウンデカン 酢酸塩
 20

